

Rec'd PCT/PTO

17 MAR 2005

日 本 国 特 許

JAPAN PATENT OFFICE

REC'D 庁

24 OCT 2003

07.10.03

PCT/JP-03/12831

別紙添付の書類に記載されている事項は下記の出願書類に記載されている事項と同一であることを証明する。

This is to certify that the annexed is a true copy of the following application as filed with this Office

出 願 年 月 日

Date of Application:

2002年10月11日

出 願 番 号

Application Number:

特願2002-298489

[ST.10/C]:

[JP 2002-298489]

出 願 人

Applicant(s):

住友化学工業株式会社

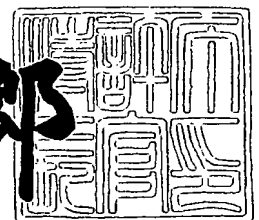
**PRIORITY
DOCUMENT**

SUBMITTED OR TRANSMITTED IN
COMPLIANCE WITH RULE 17.1 (a) OR (b)

2003年 6月 4日

特 許 庁 長 官
Commissioner,
Japan Patent Office

太田 信一郎



BEST AVAILABLE COPY 出証番号 出証特2003-3043348

【書類名】 特許願

【整理番号】 P154930

【提出日】 平成14年10月11日

【あて先】 特許庁長官殿

【国際特許分類】 A01N 48/836
C07D285/08

【発明者】

 【住所又は居所】 兵庫県宝塚市高司4丁目2番1号 住友化学工業株式会社
社内

 【氏名】 井原 秀樹

【特許出願人】

 【識別番号】 000002093

 【氏名又は名称】 住友化学工業株式会社

【代理人】

 【識別番号】 100093285

 【弁理士】

 【氏名又は名称】 久保山 隆

 【電話番号】 06-6220-3405

【選任した代理人】

 【識別番号】 100113000

 【弁理士】

 【氏名又は名称】 中山 亨

 【電話番号】 06-6220-3405

【選任した代理人】

 【識別番号】 100119471

 【弁理士】

 【氏名又は名称】 榎本 雅之

 【電話番号】 06-6220-3405

【手数料の表示】

【予納台帳番号】 010238

【納付金額】 21,000円

【提出物件の目録】

【物件名】 明細書 1

【物件名】 要約書 1

【包括委任状番号】 0212949

【プルーフの要否】 要

【書類名】

明細書

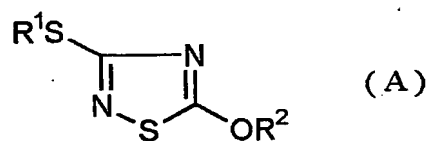
【発明の名称】

チアジアゾール化合物およびその用途

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式 (A)



[式中、

R¹は

C1-C7アルキル基、

C3-C7アルケニル基、

C3-C7アルキニル基、

C2-C7アルコシアルキル基、

C2-C7アルキルチオアルキル基、

C3-C7アルコシアルコシアルキル基、

C3-C7アルキルチオアルコシアルキル基、

置換されていてもよいフェニル基、

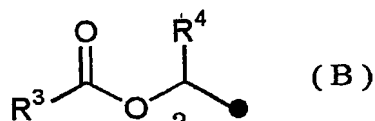
(置換されていてもよいフェニル) C1-C2アルキル基、

(置換されていてもよいフェニルオキシ) C1-C2アルキル基、

(置換されていてもよいフェニル) C2-C3アルコシアルキル基、

又は

式 (B)



(式中、R³はC1-C3アルキル基を表し、R⁴は水素原子、メチル基、エチル基、プロピル基又は置換されていてもよいフェニル基を表す。)を表し、

R²は(置換されていてもよい含酸素又は含硫黄5員環複素環式基)で置換されたC1-C4アルキル基を表す。]

で示されるチアジアゾール化合物。

【請求項 2】

請求項 1 記載のチアジアゾール化合物を有効成分として含有することを特徴とする有害節足動物防除剤。

【請求項 3】

請求項 1 記載のチアジアゾール化合物の有効量を有害節足動物又は有害節足動物の生息場所に施用することを特徴とする有害節足動物の防除方法。

【発明の詳細な説明】

【0001】

【発明の属する技術分野】

本発明は、チアジアゾール化合物及びその用途に関する。

【0002】

【従来の技術】

従来より、有害節足動物の防除を目的として種々の有害節足動物防除剤が用いられている。

【0003】

【特許文献 1】

西独国特許公開第 3 0 3 0 6 6 1 A 1 号明細書

【0004】

【発明が解決しようとする課題】

しかし、これらの薬剤は必ずしも十分な効力を有さない場合があり、新しい有害節足動物防除剤の開発が求められている。

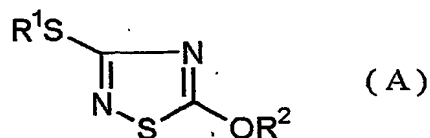
本発明は、有害節足動物防除効力を有する新しい化合物及びその化合物の有害節足動物防除用途を提供することを課題とする。

【0005】

【課題を解決するための手段】

本発明者は有害節足動物防除効力を有する化合物を見出すべく鋭意検討した結果、下記式 (A) で示されるチアジアゾール化合物が優れた有害生物防除効力を有することを見出し、本発明を完成した。

すなわち、本発明は式 (A)



[式中、

R¹は

C1-C7アルキル基、

C3-C7アルケニル基、

C3-C7アルキニル基、

C2-C7アルコキシアルキル基、

C2-C7アルキルチオアルキル基、

C3-C7アルコキシアルコキシアルキル基、

C3-C7アルキルチオアルコキシアルキル基、

置換されていてもよいフェニル基、

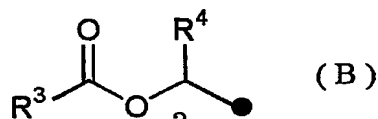
(置換されていてもよいフェニル) C1-C2アルキル基、

(置換されていてもよいフェニルオキシ) C1-C2アルキル基、

(置換されていてもよいフェニル) C2-C3アルコキシアルキル基

又は

式 (B)



(式中、R³はC1-C3アルキル基を表し、R⁴は水素原子、メチル基、エチル基、プロピル基又は置換されていてもよいフェニル基を表す。)を表し、R²は(置換されていてもよい含酸素又は含硫黄5員環複素環式基)で置換されたC1-C4アルキル基を表す。]

で示されるチアジアゾール化合物(以下、本発明化合物と記す。)、本発明化合物を有効成分として含有することを特徴とする有害節足動物防除剤及び本発明化合物の有効量を有害節足動物又は有害節足動物の生息場所に施用することを特徴とする有害節足動物の防除方法を提供する。

【0006】

【発明の実施の形態】

本発明化合物において、

R¹で示される、

C1-C7アルキル基としては、例えばメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、sec-ブチル基及びtert-ブチル基が挙げられ；

C3-C7アルケニル基としては、例えばアリル基、2-ブテニル基、3-メチル-2-ブテニル基及び2-ペンテニル基が挙げられ；

C3-C7アルキニル基としては、例えば2-プロピニル基、1-メチル-2-プロピニル基、2-ブチニル基、3-ブチニル基及び2-ペンチニル基が挙げられ；

C2-C7アルコキシアルキル基としては、例えば(C1-C6アルコキシ)メチル基が挙げられ、具体的には例えばメトキシメチル基、エトキシメチル基、プロポキシメチル基及びイソプロポキシメチル基が挙げられ；

C2-C7アルキルチオアルキル基としては、例えば(C1-C6アルキルチオ)アルキル基が挙げられ、具体的には例えばメチルチオメチル基、エチルチオメチル基、プロピルチオメチル基及びイソプロピルチオメチル基が挙げられ；

C3-C7アルコキシアルコキシアルキル基としては、例えばメトキシエトキシメチル基が挙げられ；

C3-C7アルキルチオアルコキシアルキル基としては、例えばエチルチオエトキシメチル基が挙げられ；

置換されていてもよいフェニル基としては、例えばC1-C4アルキル基(メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、tert-ブチル基等)、C1-C4ハロアルキル基(トリフルオロメチル基、ジフルオロメチル基、ペンタフルオロエチル基等)、C1-C4アルコキシ基(メトキシ基、エトキシ基、プロポキシ基、イソプロポキシ等)、C1-C4アルキルチオ基(メチルチオ基、エチルチオ基等)、C1-C2ハロアルコキシ基(トリフルオロメトキシ基、ジフルオロメトキシ基等)、ニトロ基、シアノ基及びハロゲン原子(フッ素原子、塩素原子、臭素原子等)からなる群より選ばれる一種以上で置換されていてもよい

フェニル基が挙げられ、具体的には例えば

フェニル基、

2-メチルフェニル基、3-メチルフェニル基、4-メチルフェニル基、

2-トリフルオロメチルフェニル基、3-トリフルオロメチルフェニル基、4-トリフルオロメチルフェニル基、

2-メトキシフェニル基、3-メトキシフェニル基、4-メトキシフェニル基、

2-メチルチオフェニル基、3-メチルチオフェニル基、4-メチルチオフェニル基、

2-トリフルオロメトキシフェニル基、3-トリフルオロメトキシフェニル基、4-トリフルオロメトキシフェニル基、

2-ニトロフェニル基、3-ニトロフェニル基、4-ニトロフェニル基、

2-シアノフェニル基、3-シアノフェニル基、4-シアノフェニル基、

2-フルオロフェニル基、3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェニル基、

3, 4-ジフルオロフェニル基、3, 5-ジフルオロフェニル基、2, 6-ジフルオロフェニル基、2, 4-ジフルオロフェニル基、

2-クロロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、3, 4-ジクロロフェニル基、3, 5-ジクロロフェニル基、2, 6-ジクロロフェニル基、2, 4-ジクロロフェニル基、

2-ブロモフェニル基、3-ブロモフェニル基、4-ブロモフェニル基、3, 4-ジブロモフェニル基、3, 5-ジブロモフェニル基、2, 6-ジブロモフェニル基及び2, 4-ジブロモフェニル基が挙げられ；

【0007】

(置換されていてもよいフェニル) C1-C2アルキル基としては、例えば[C1-C4アルキル基(メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、tert-ブチル基等)、C1-C4ハロアルキル基(トリフルオロメチル基、ジフルオロメチル基、ペンタフルオロエチル基等)、C1-C4アルコキシ基(メトキシ基、エトキシ基、プロポキシ基、イソプロポキシ基等)、C1-C4アルキルチオ基(メチルチオ基、エチルチオ基等)、C1-C2ハロアルコキシ基(トリフルオロメトキシ基、ジフルオロメトキシ基等)、ニトロ基、シアノ基及びハロ

ゲン原子（フッ素原子、塩素原子、臭素原子等）からなる群より選ばれる一種以上で置換されていてもよいフェニル] C1-C2アルキル基が挙げられ、具体的には例えば

ベンジル基、

2-メチルベンジル基、3-メチルベンジル基、4-メチルベンジル基、

2-トリフルオロメチルベンジル基、3-トリフルオロメチルベンジル基、4-トリフルオロメチルベンジル基、

2-メトキシベンジル基、3-メトキシベンジル基、4-メトキシベンジル基、

2-メチルチオベンジル基、3-メチルチオベンジル基、4-メチルチオベンジル基、

2-トリフルオロメトキシベンジル基、3-トリフルオロメトキシベンジル基、

4-トリフルオロメトキシベンジル基、

2-ニトロベンジル基、3-ニトロベンジル基、4-ニトロベンジル基、

2-シアノベンジル基、3-シアノベンジル基、4-シアノベンジル基、

2-フルオロベンジル基、3-フルオロベンジル基、4-フルオロベンジル基、

3, 4-ジフルオロベンジル基、3, 5-ジフルオロベンジル基、2, 6-ジフルオロベンジル基、2, 4-ジフルオロベンジル基、

2-クロロベンジル基、3-クロロベンジル基、4-クロロベンジル基、3, 4-

-ジクロロベンジル基、3, 5-ジクロロベンジル基、2, 6-ジクロロベンジル基、2, 4-ジクロロベンジル基、

2-ブロモベンジル基、3-ブロモベンジル基、4-ブロモベンジル基、3, 4-

-ジブロモベンジル基、3, 5-ジブロモベンジル基、2, 6-ジブロモベンジル基、2, 4-ジブロモベンジル基、

【0008】

1-フェニルエチル基、

1-(2-メチルフェニル)エチル基、1-(3-メチルフェニル)エチル基、

1-(4-メチルフェニル)エチル基、

1-(2-トリフルオロメチルフェニル)エチル基、1-(3-トリフルオロメチルフェニル)エチル基、1-(4-トリフルオロメチルフェニル)エチル基、

1-(2-メトキシフェニル)エチル基、1-(3-メトキシフェニル)エチル基、1-(4-メトキシフェニル)エチル基、

1-(2-メチルチオフェニル)エチル基、1-(3-メチルチオフェニル)エチル基、1-(4-メチルチオフェニル)エチル基、

1-(2-トリフルオロメトキシフェニル)エチル基、1-(3-トリフルオロメトキシフェニル)エチル基、1-(4-トリフルオロメトキシフェニル)エチル基、

1-(2-ニトロフェニル)エチル基、1-(3-ニトロフェニル)エチル基、1-(4-ニトロフェニル)エチル基、

1-(2-シアノフェニル)エチル基、1-(3-シアノフェニル)エチル基、1-(4-シアノフェニル)エチル基、

1-(2-フルオロフェニル)エチル基、1-(3-フルオロフェニル)エチル基、1-(4-フルオロフェニル)エチル基、1-(3,4-ジフルオロフェニル)エチル基、1-(3,5-ジフルオロフェニル)エチル基、1-(2,6-ジフルオロフェニル)エチル基、1-(2,4-ジフルオロフェニル)エチル基、

1-(2-クロロフェニル)エチル基、1-(3-クロロフェニル)エチル基、1-(4-クロロフェニル)エチル基、1-(3,4-ジクロロフェニル)エチル基、1-(3,5-ジクロロフェニル)エチル基、1-(2,6-ジクロロフェニル)エチル基、1-(2,4-ジクロロフェニル)エチル基、

1-(2-ブロモフェニル)エチル基、1-(3-ブロモフェニル)エチル基、1-(4-ブロモフェニル)エチル基、1-(3,4-ジブロモフェニル)エチル基、1-(3,5-ジブロモフェニル)エチル基、1-(2,6-ジブロモフェニル)エチル基、1-(2,4-ジブロモフェニル)エチル基、

【0009】

2-フェニルエチル基、

2-(2-メチルフェニル)エチル基、2-(3-メチルフェニル)エチル基、

2-(4-メチルフェニル)エチル基、

2-(2-トリフルオロメチルフェニル)エチル基、2-(3-トリフルオロメ

チルフェニル) エチル基、2-(4-トリフルオロメチルフェニル) エチル基、
2-(2-メトキシフェニル) エチル基、2-(3-メトキシフェニル) エチル
基、2-(4-メトキシフェニル) エチル基、

2-(2-メチルチオフェニル) エチル基、2-(3-メチルチオフェニル) エ
チル基、2-(4-メチルチオフェニル) エチル基、

2-(2-トリフルオロメトキシフェニル) エチル基、2-(3-トリフルオロ
メトキシフェニル) エチル基、2-(4-トリフルオロメトキシフェニル) エチ
ル基、

2-(2-ニトロフェニル) エチル基、2-(3-ニトロフェニル) エチル基、
2-(4-ニトロフェニル) エチル基、

2-(2-シアノフェニル) エチル基、2-(3-シアノフェニル) エチル基、
2-(4-シアノフェニル) エチル基、

2-(2-フルオロフェニル) エチル基、2-(3-フルオロフェニル) エチル
基、2-(4-フルオロフェニル) エチル基、2-(3, 4-ジフルオロフェニ
ル) エチル基、2-(3, 5-ジフルオロフェニル) エチル基、2-(2, 6-
ジフルオロフェニル) エチル基、2-(2, 4-ジフルオロフェニル) エチル基

2-(2-クロロフェニル) エチル基、2-(3-クロロフェニル) エチル基、
2-(4-クロロフェニル) エチル基、2-(3, 4-ジクロロフェニル) エチ
ル基、2-(3, 5-ジクロロフェニル) エチル基、2-(2, 6-ジクロロフ
ェニル) エチル基、2-(2, 4-ジクロロフェニル) エチル基、

2-(2-ブロモフェニル) エチル基、2-(3-ブロモフェニル) エチル基、
2-(4-ブロモフェニル) エチル基、2-(3, 4-ジブロモフェニル) エチ
ル基、2-(3, 5-ジブロモフェニル) エチル基、2-(2, 6-ジブロモフ
ェニル) エチル基及び2-(2, 4-ジブロモフェニル) エチル基が挙げられ；

【0010】

(置換されていてもよいフェニルオキシ) C1-C2アルキル基としては、例え
ば[C1-C4アルキル基(メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基
、tert-ブチル基等)、C1-C4ハロアルキル基(トリフルオロメチル基

、ジフルオロメチル基、ペンタフルオロエチル基等)、C1-C4アルコキシ基
(メトキシ基、エトキシ基、プロポキシ基、イソプロポキシ等)、C1-C4ア
ルキルチオ基(メチルチオ基、エチルチオ基等)、C1-C2ハロアルコキシ基
(トリフルオロメトキシ基、ジフルオロメトキシ基等)、ニトロ基、シアノ基及
びハロゲン原子(フッ素原子、塩素原子、臭素原子等)からなる群より選ばれる
一種以上で置換されていてもよいフェニルオキシ]C1-C2アルキル基が挙げ
られ、具体的には例えば

フェニルオキシメチル基、1-(フェニルオキシ)エチル基、2-(フェニルオ
キシ)エチル基、

(2-メチルフェニル)オキシメチル基、(3-メチルフェニル)オキシメチル
基、(4-メチルフェニル)オキシメチル基、

(2-トリフルオロメチルフェニル)オキシメチル基、(3-トリフルオロメチ
ルフェニル)オキシメチル基、(4-トリフルオロメチルフェニル)オキシメチ
ル基、

(2-メトキシフェニル)オキシメチル基、(3-メトキシフェニル)オキシメ
チル基、(4-メトキシフェニル)オキシメチル基、

(2-メチルチオフェニル)オキシメチル基、(3-メチルチオフェニル)オキ
シメチル基、(4-メチルチオフェニル)オキシメチル基、

(2-トリフルオロメトキシフェニル)オキシメチル基、(3-トリフルオロメ
トキシフェニル)オキシメチル基、(4-トリフルオロメトキシフェニル)オキ
シメチル基、

(2-ニトロフェニル)オキシメチル基、(3-ニトロフェニル)オキシメチル
基、(4-ニトロフェニル)オキシメチル基、

(2-シアノフェニル)オキシメチル基、(3-シアノフェニル)オキシメチル
基、(4-シアノフェニル)オキシメチル基、

(2-フルオロフェニル)オキシメチル基、(3-フルオロフェニル)オキシメ
チル基、(4-フルオロフェニル)オキシメチル基、(3,4-ジフルオロフェ
ニル)オキシメチル基、(3,5-ジフルオロフェニル)オキシメチル基、(2
,6-ジフルオロフェニル)オキシメチル基、(2,4-ジフルオロフェニル)

オキシメチル基、

(2-クロロフェニル) オキシメチル基、(3-クロロフェニル) オキシメチル基、(4-クロロフェニル) オキシメチル基、(3, 4-ジクロロフェニル) オキシメチル基、(3, 5-ジクロロフェニル) オキシメチル基、(2, 6-ジクロロフェニル) オキシメチル基、(2, 4-ジクロロフェニル) オキシメチル基、

(2-ブロモフェニル) オキシメチル基、(3-ブロモフェニル) オキシメチル基、(4-ブロモフェニル) オキシメチル基、(3, 4-ジブロモフェニル) オキシメチル基、(3, 5-ジブロモフェニル) オキシメチル基、(2, 6-ジブロモフェニル) オキシメチル基及び(2, 4-ジブロモフェニル) オキシメチル基が挙げられ、

【0011】

(置換されていてもよいフェニル) C2-C3アルコキシアシル基としては、例えば[C1-C4アルキル基(メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、tert-ブチル基等)、C1-C4ハロアルキル基(トリフルオロメチル基、ジフルオロメチル基、ペンタフルオロエチル基等)、C1-C4アルコキシ基(メトキシ基、エトキシ基、プロポキシ基、イソプロポキシ等)、C1-C4アルキルチオ基(メチルチオ基、エチルチオ基等)、C1-C2ハロアルコキシ基(トリフルオロメトキシ基、ジフルオロメトキシ基等)、ニトロ基、シアノ基及びハロゲン原子(フッ素原子、塩素原子、臭素原子等)からなる群より選ばれる一種以上で置換されていてもよいベンジル] オキシメチル基が挙げられ、

具体的には例えば

ベンジルオキシメチル基、

(2-メチルベンジル) オキシメチル基、(3-メチルベンジル) オキシメチル基、(4-メチルベンジル) オキシメチル基、

(2-トリフルオロメチルベンジル) オキシメチル基、(3-トリフルオロメチルベンジル) オキシメチル基、(4-トリフルオロメチルベンジル) オキシメチル基、

(2-メトキシベンジル) オキシメチル基、(3-メトキシベンジル) オキシメ

チル基、(4-メトキシベンジル)オキシメチル基、

(2-メチルチオベンジル)オキシメチル基、(3-メチルチオベンジル)オキシメチル基、(4-メチルチオベンジル)オキシメチル基、

(2-トリフルオロメトキシベンジル)オキシメチル基、(3-トリフルオロメトキシベンジル)オキシメチル基、(4-トリフルオロメトキシベンジル)オキシメチル基、

(2-ニトロベンジル)オキシメチル基、(3-ニトロベンジル)オキシメチル基、(4-ニトロベンジル)オキシメチル基、

(2-シアノベンジル)オキシメチル基、(3-シアノベンジル)オキシメチル基、(4-シアノベンジル)オキシメチル基、

(2-フルオロベンジル)オキシメチル基、(3-フルオロベンジル)オキシメチル基、(4-フルオロベンジル)オキシメチル基、(3,4-ジフルオロベンジル)オキシメチル基、(3,5-ジフルオロベンジル)オキシメチル基、(2,6-ジフルオロベンジル)オキシメチル基、(2,4-ジフルオロベンジル)オキシメチル基、

(2-クロロベンジル)オキシメチル基、(3-クロロベンジル)オキシメチル基、(4-クロロベンジル)オキシメチル基、(3,4-ジクロロベンジル)オキシメチル基、(3,5-ジクロロベンジル)オキシメチル基、(2,6-ジクロロベンジル)オキシメチル基、(2,4-ジクロロベンジル)オキシメチル基、

(2-ブロモベンジル)オキシメチル基、(3-ブロモベンジル)オキシメチル基、(4-ブロモベンジル)オキシメチル基、(3,4-ジブロモベンジル)オキシメチル基、(3,5-ジブロモベンジル)オキシメチル基、(2,6-ジブロモベンジル)オキシメチル基、(2,4-ジブロモベンジル)オキシメチル基が挙げられる。

【0012】

式(B)で示される基としては例えば式(B)において R^3 がC1-C3アルキル基であり、 R^4 が水素原子又は[C1-C4アルキル基(メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、tert-ブチル基等)、C1-C4ハロア

ルキル基（トリフルオロメチル基、ジフルオロメチル基、ペンタフルオロメチル基等）、C1-C4アルコキシ基（メトキシ基、エトキシ基、プロポキシ基、イソプロポキシ等）、C1-C4アルキルチオ基（メチルチオ基、エチルチオ基等）、C1-C2ハロアルコキシ基（トリフルオロメトキシ基、ジフルオロメトキシ基等）、ニトロ基、シアノ基及びハロゲン原子（フッ素原子、塩素原子、臭素原子等）からなる群より選ばれる一種以上で置換されていてもよいフェニル基である基が挙げられ、具体的には例えばアセトキシメチル基及び α -アセチルオキシベンジル基が挙げられる。

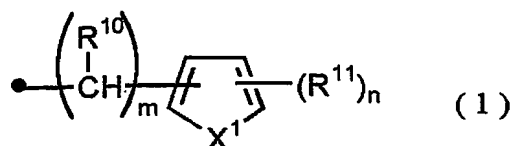
【0013】

R^2 で示される（置換されていてもよい含酸素又は含硫黄5員環複素環式基）で置換されたC1-C4アルキル基としては、例えば{C1-C4アルキル基（メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、tert-ブチル基等）、ハロゲン原子（フッ素原子、塩素原子、臭素原子等）、トリフルオロメチル基、ホルミル基及びニトロ基からなる群より選ばれる1種以上で置換されていてもよい含酸素又は含硫黄5員環複素環式基}で置換されたC1-C4アルキル基が挙げられ、具体的には例えば{ハロゲン原子（フッ素原子、塩素原子、臭素原子等）、C1-C4アルキル基（メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、tert-ブチル基等）、トリフルオロメチル基、ホルミル基及びニトロ基からなる群より選ばれる1種以上で置換されていてもよい含酸素又は含硫黄5員環複素環式基}で置換されたメチル基及び1位が{C1-C4アルキル基（メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、tert-ブチル基等）、ハロゲン原子（フッ素原子、塩素原子、臭素原子等）、トリフルオロメチル基、ホルミル基及びニトロ基からなる群より選ばれる1種以上で置換されていてもよい含酸素又は含硫黄5員環複素環式基}で置換されたエチル基が挙げられる。

【0014】

R^2 で示される（置換されていてもよい含酸素又は含硫黄5員環複素環式基）で置換されたC1-C4アルキル基の態様としては、例えば下式（1）～式（10）で示される基が挙げられる。

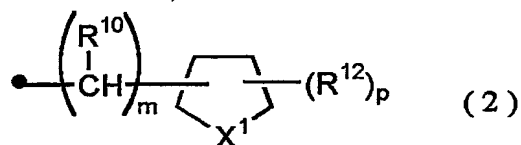
式（1）



(式中、 R^{10} は水素原子又はメチル基を表し、 R^{11} はハロゲン原子、C1-C4アルキル基、トリフルオロメチル基、ホルミル基又はニトロ基を表し、 X^1 は酸素原子又は硫黄原子を表し、 m は1又は2を表し、 n は0～3の整数を表す。なお、 n が2以上の整数である場合には各々の R^{11} は同一でも相異なってもよい。)

【0015】

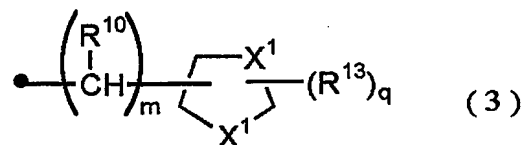
式(2)



(式中、 R^{10} は水素原子又はメチル基を表し、 R^{12} はC1-C4アルキル基を表し、 X^1 は酸素原子又は硫黄原子を表し、 m は1又は2を表し、 p は0～7の整数を表す。なお、 p が2以上の整数である場合には各々の R^{12} は同一でも相異なってもよい。)

【0016】

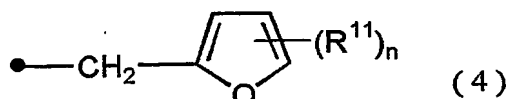
式(3)



(式中、 R^{10} は水素原子又はメチル基を表し、 R^{13} はC1-C4アルキル基を表し、 X^1 は酸素原子又は硫黄原子を表し、 m は1又は2を表し、 q は0～5の整数を表す。なお、 q が2以上の整数である場合には各々の R^{13} は同一でも相異なってもよい。)

【0017】

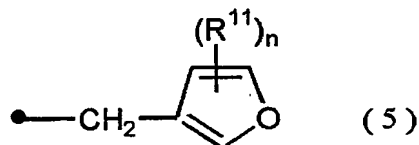
式(4)



(式中、 R^{11} はハロゲン原子、C1-C4アルキル基、トリフルオロメチル基、ホルミル基又はニトロ基を表し、 n は0～3の整数を表す。なお、 n が2以上の整数である場合には各々の R^{11} は同一でも相異なっているもよい。)

【0018】

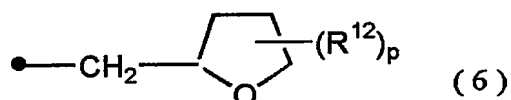
式(5)



(式中、 R^{11} はハロゲン原子、C1-C4アルキル基、トリフルオロメチル基、ホルミル基又はニトロ基を表し、 n は0～3の整数を表す。 n が2以上の整数である場合には各々の R^{11} は同一でも相異なっているもよい。)

【0019】

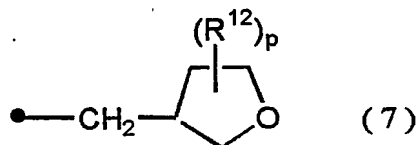
式(6)



(式中、 R^{12} はC1-C4アルキル基を表し、 p は0～7の整数を表す。なお、 p が2以上の整数である場合には各々の R^{12} は同一でも相異なっているもよい。)

【0020】

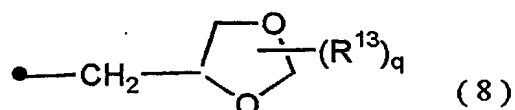
式(7)



(式中、 R^{12} はC1-C4アルキル基を表し、 p は0～7の整数を表す。なお、 p が2以上の整数である場合には各々の R^{12} は同一でも相異なっているもよい。)

【0021】

式 (8)

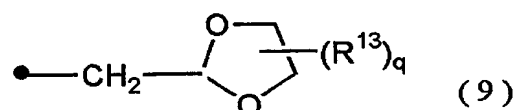


(式中、 R^{13} はC1-C4アルキル基を表し、 q は0～5の整数を表す。なお、 q が2以上の整数である場合には各々の R^{13} は同一でも相異なっているもよい。

)

【0022】

式 (9)

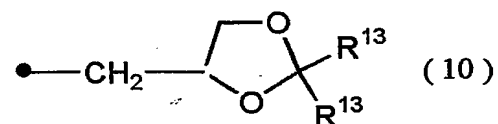


(式中、 R^{13} はC1-C4アルキル基を表し、 q は0～5の整数を表す。なお、 q が2以上の整数である場合には各々の R^{13} は同一でも相異なっているもよい。

)

【0023】

式 (10)



(式中、 R^{13} はC1-C4アルキル基を表す。なお、2個の R^{13} は同一でも相異なっているもよい。)

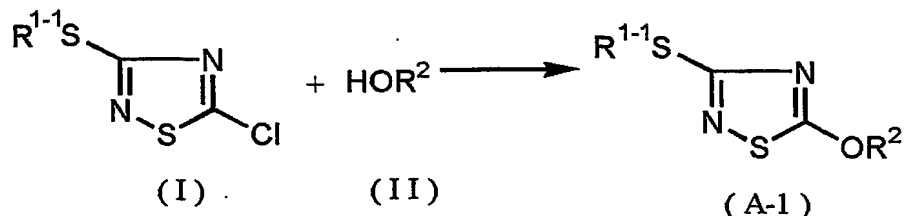
【0024】

次に本発明化合物の製造法について説明する。

本発明化合物のうち、

R^1 がC1-C7アルキル基、C3-C7アルケニル基、C3-C7アルキニル基、C2-C7アルコキシアルキル基、C2-C7アルキルチオアルキル基、C3-C7アルコキシアルコキシアルキル基、C3-C7アルキルチオアルコキシアルキル基、置換されていてもよいフェニル基、(置換されていてもよいフェニル) C1-C2アルキル基、(置換されていてもよいフェニルオキシ) C1-C2アルキル基又は(置換されていてもよいフェニル) C2-C3アルコキシアル

キル基である化合物（式（A-1）で示される化合物）は例えば式（I）で示される 5-クロロ-1, 2, 4-チアジアゾール化合物と式（II）で示されるアルコール化合物とを反応させることにより製造することができる。



（式中、 R^{1-1} はC1-C7アルキル基、C3-C7アルケニル基、C3-C7アルキニル基、C2-C7アルコキシアルキル基、C2-C7アルキルチオアルキル基、C3-C7アルコキシアルコキシアルキル基、C3-C7アルキルチオアルコキシアルキル基、置換されていてもよいフェニル基、（置換されていてもよいフェニル）C1-C2アルキル基、（置換されていてもよいフェニルオキシ）C1-C2アルキル基又は（置換されていてもよいフェニル）C2-C3アルコキシアルキル基を表し、 R^2 は前記と同じ意味を表す。）

該反応は通常塩基の存在下、通常溶媒中で行われる。

反応に用いられる溶媒としては、例えばヘキサン、ヘプタン、オクタン等の脂肪族炭化水素類、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、テトラヒドロフラン、1, 4-ジオキサン、メチル-tert-ブチルエーテル、1, 2-ジメトキシエタン等のエーテル類、N, N-ジメチルホルムアミド及びこれらの混合物が挙げられる。

反応に用いられる塩基としては、例えば炭酸カリウム、炭酸ナトリウム等の炭酸塩及びこれらの混合物が挙げられる。

反応に用いられる試剤の量は、式（I）で示される 5-クロロ-1, 2, 4-チアジアゾール化合物 1 モルに対して、式（II）で示されるアルコール化合物が通常 1～1.5 モルの割合であり、塩基が式（II）で示されるアルコール化合物 1 モルに対して通常 1～1.5 モルの割合である。

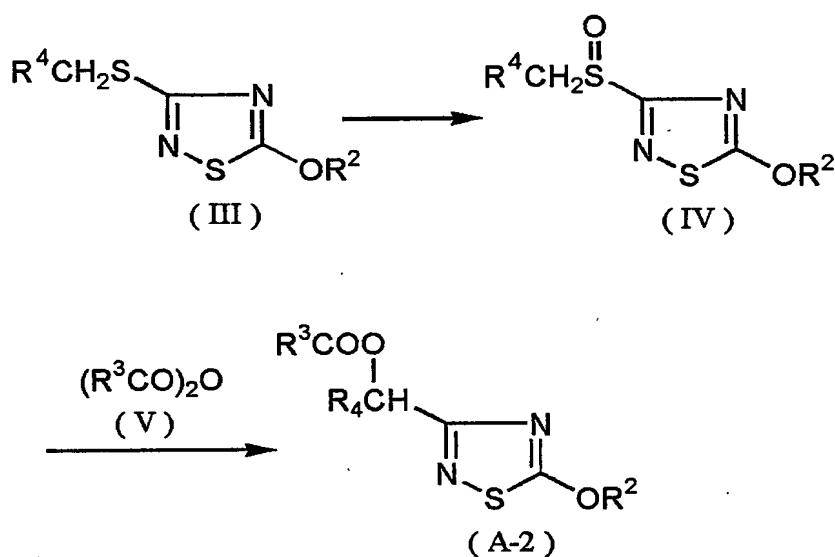
該反応の反応温度は通常-20～80℃の範囲、反応時間は通常0.5～24時間の範囲である。

反応終了後は、例えば反応混合物を水に注加し、有機溶媒抽出して得られる有

機層を乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、式(A-1)で示される本発明化合物を単離することができる。単離した式(A-1)で示される本発明化合物は必要に応じてクロマトグラフィー、再結晶等の操作によりさらに精製することもできる。

【0025】

本発明化合物のうち、 R^1 が式(B)で示される基である化合物(式(A-2)で示される化合物)は例えば式(III)で示されるチアジアゾール化合物と酸化剤とを反応させ(前半工程)、次いで式(V)で示される酸無水物とを反応させる(後半工程)ことにより製造することができる。



(式中、 R^2 、 R^3 及び R^4 は前記と同じ意味を表す。)

【0026】

(前半工程)

前半工程の反応は通常溶媒中で行われる。反応に用いられる溶媒としては、例えばジクロロメタン、クロロホルム等の脂肪族ハロゲン化炭化水素類及び水が挙げられる。

該反応に用いられる酸化剤としては例えば3-クロロ過安息香酸等の過酸が挙げられる。反応に用いられる酸化剤の量は式(III)で示されるチアジアゾール化合物1モルに対して通常1～1.5モルの割合である。

該反応の反応温度は通常-20～30℃の範囲であり、反応時間は通常瞬時～

24時間の範囲である。

反応終了後は、例えば反応混合物を水に注加し、有機溶媒抽出して得られた有機層を必要に応じて還元剤（亜硫酸ナトリウム、チオ硫酸ナトリウム等）の水溶液、塩基（炭酸水素ナトリウム等）の水溶液等で洗浄し、乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより式（I V）で示されるスルホキシド化合物を単離することができる。単離した式（I V）で示されるスルホキシド化合物は、クロマトグラフィー、再結晶等によりさらに精製することもできる。

【0027】

（後半工程）

後半工程は式（I V）で示されるスルホキシド化合物と式（V）で示される酸無水物とを反応させることにより行われる。

該反応は溶媒の存在下又は非存在下、通常塩基の存在下で行われる。

反応に用いられる塩基としては、例えば2, 6-ルチジン等のピリジン類及び酢酸ナトリウム等の酢酸のアルカリ金属塩が挙げられる。

反応に用いられる試剤の量は式（I V）で示されるスルホキシド化合物1モルに対して、式（V）で示される酸無水物が1～50モルの割合であり、塩基が1～10モルの割合である。

該反応は、必要に応じてトリフルオロ酢酸無水物の存在下で行うこともできる。この場合のトリフルオロ酢酸無水物の量は式（I V）で示されるスルホキシド化合物1モルに対して0.01～5モルの割合である。

該反応の反応温度は通常0～150℃の範囲であり、反応時間は通常1～72時間の範囲である。

反応終了後は、例えば反応混合物を塩基（炭酸水素ナトリウム等）の水溶液に注加し、有機溶媒抽出して得られる有機層を、乾燥、濃縮する等の後処理操作を行うことにより、式（A-2）で示される本発明化合物を単離することができる。単離した式（A-2）で示される本発明化合物は、必要に応じてクロマトグラフィー、再結晶等の操作によりさらに精製することもできる。

【0028】

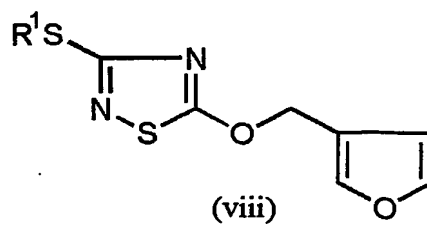
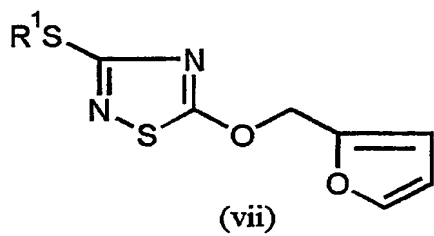
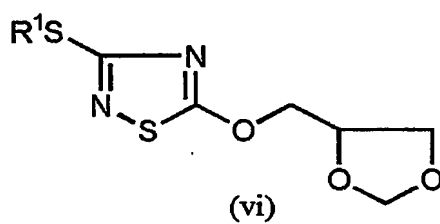
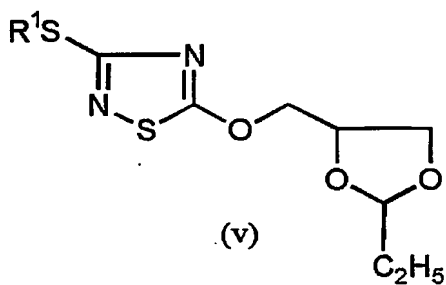
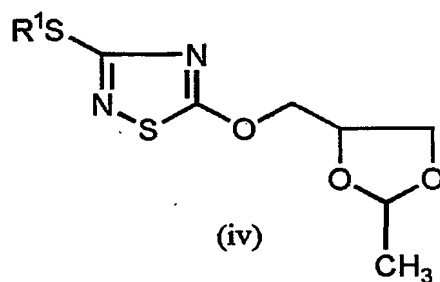
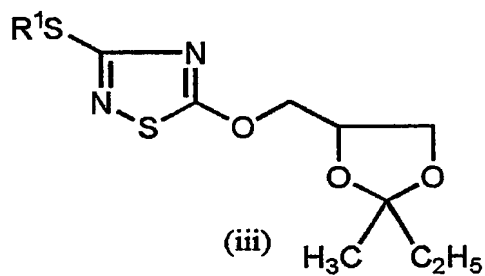
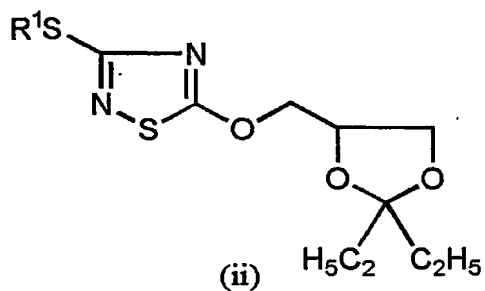
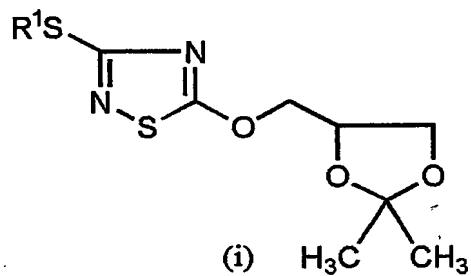
式（I）で示される化合物は例えばChem. Ber. 90, 892 (195

7) に記載された方法に準じて製造することができる。

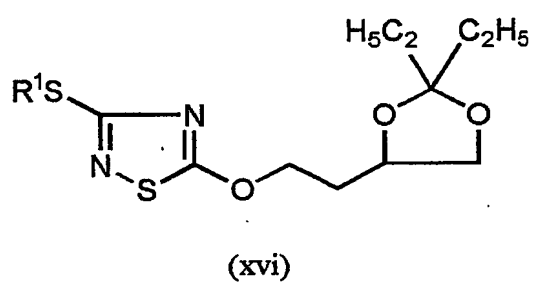
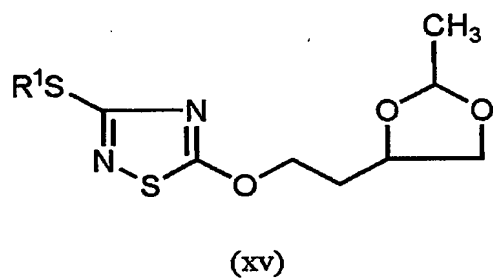
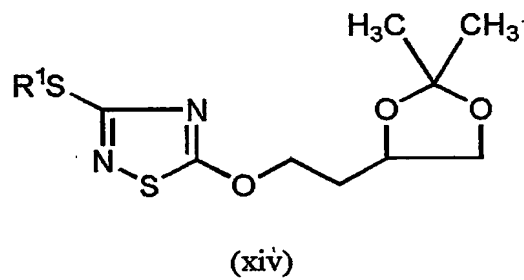
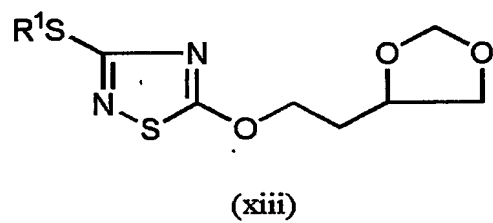
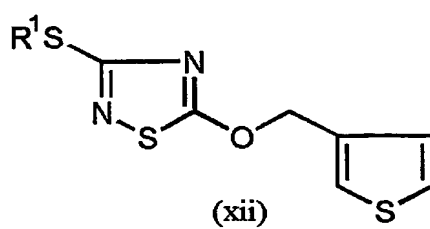
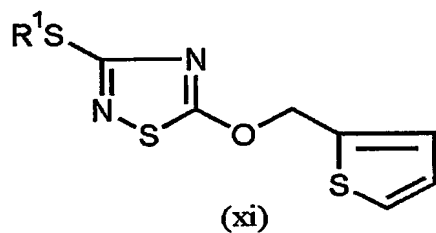
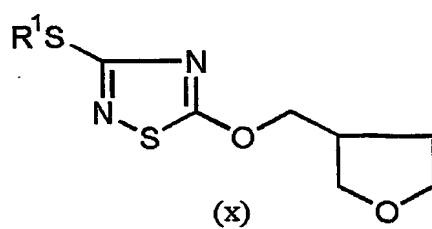
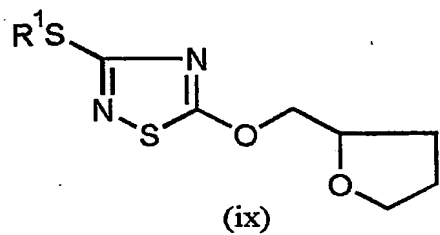
【0029】

次に、本化合物の一例を示す。

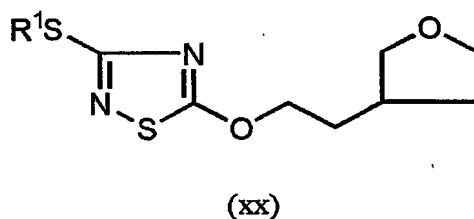
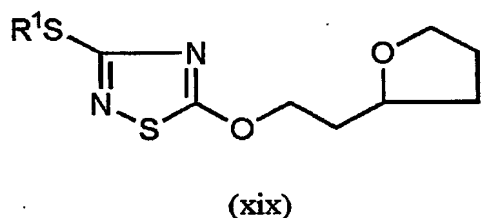
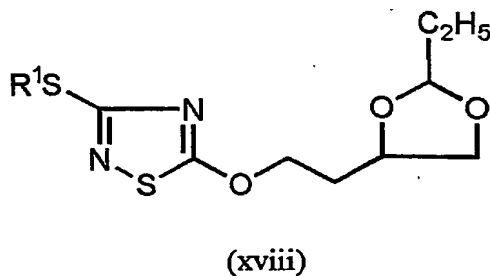
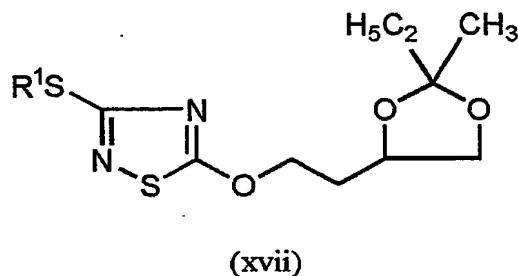
【0030】



【0031】



【0032】



【0033】

式(i)～式(xx)においてR¹は、

メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、sec-ブチル基、tert-ブチル基、

アリル基、2-ブテニル基、3-メチル-2-ブテニル基、2-ペンテニル基、2-プロピニル基、1-メチル-2-プロピニル基、2-ブチニル基、3-ブチニル基、2-ペンチニル基、

メトキシメチル基、エトキシメチル基、プロポキシメチル基、イソプロポキシメチル基、ブトキシメチル基、イソブトキシメチル基、sec-ブトキシメチル基、tert-ブトキシメチル基、

メチルチオメチル基、エチルチオメチル基、プロピルチオメチル基、イソプロピルチオメチル基

メトキシエトキシメチル基、エトキシエトキシメチル基、

メチルチオエトキシメチル基、

【0034】

フェニル基、

2-メチルフェニル基、3-メチルフェニル基、4-メチルフェニル基、

2-トリフルオロメチルフェニル基、3-トリフルオロメチルフェニル基、4-

トリフルオロメチルフェニル基、

2-メトキシフェニル基、3-メトキシフェニル基、4-メトキシフェニル基、

2-メチルチオフェニル基、3-メチルチオフェニル基、4-メチルチオフェニル基、

2-トリフルオロメトキシフェニル基、3-トリフルオロメトキシフェニル基、

4-トリフルオロメトキシフェニル基、

2-ニトロフェニル基、3-ニトロフェニル基、4-ニトロフェニル基、

2-シアノフェニル基、3-シアノフェニル基、4-シアノフェニル基、

2-フルオロフェニル基、3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェニル基、

3, 4-ジフルオロフェニル基、3, 5-ジフルオロフェニル基、2, 6-ジフルオロフェニル基、2, 4-ジフルオロフェニル基、

2-クロロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、3, 4-ジクロロフェニル基、3, 5-ジクロロフェニル基、2, 6-ジクロロフェニル基、2, 4-ジクロロフェニル基、

2-ブロモフェニル基、3-ブロモフェニル基、4-ブロモフェニル基、3, 4-ジブロモフェニル基、3, 5-ジブロモフェニル基、2, 6-ジブロモフェニル基、2, 4-ジブロモフェニル基、

【0035】

ベンジル基、

2-メチルベンジル基、3-メチルベンジル基、4-メチルベンジル基、

2-トリフルオロメチルベンジル基、3-トリフルオロメチルベンジル基、4-トリフルオロメチルベンジル基、

2-メトキシベンジル基、3-メトキシベンジル基、4-メトキシベンジル基、

2-メチルチオベンジル基、3-メチルチオベンジル基、4-メチルチオベンジル基、

2-トリフルオロメトキシベンジル基、3-トリフルオロメトキシベンジル基、

4-トリフルオロメトキシベンジル基、

2-ニトロベンジル基、3-ニトロベンジル基、4-ニトロベンジル基、

2-シアノベンジル基、3-シアノベンジル基、4-シアノベンジル基、

2-フルオロベンジル基、3-フルオロベンジル基、4-フルオロベンジル基、
3,4-ジフルオロベンジル基、3,5-ジフルオロベンジル基、2,6-ジフルオロベンジル基、2,4-ジフルオロベンジル基、

2-クロロベンジル基、3-クロロベンジル基、4-クロロベンジル基、3,4-ジクロロベンジル基、3,5-ジクロロベンジル基、2,6-ジクロロベンジル基、2,4-ジクロロベンジル基、

2-ブロモベンジル基、3-ブロモベンジル基、4-ブロモベンジル基、3,4-ジブロモベンジル基、3,5-ジブロモベンジル基、2,6-ジブロモベンジル基、2,4-ジブロモベンジル基、

【0036】

1-(フェニル)エチル基、

1-(2-メチルフェニル)エチル基、1-(3-メチルフェニル)エチル基、

1-(4-メチルフェニル)エチル基、

1-(2-トリフルオロメチルフェニル)エチル基、1-(3-トリフルオロメチルフェニル)エチル基、1-(4-トリフルオロメチルフェニル)エチル基、

1-(2-メトキシフェニル)エチル基、1-(3-メトキシフェニル)エチル基、1-(4-メトキシフェニル)エチル基、

1-(2-メチルチオフェニル)エチル基、1-(3-メチルチオフェニル)エチル基、1-(4-メチルチオフェニル)エチル基、

1-(2-トリフルオロメトキシフェニル)エチル基、1-(3-トリフルオロメトキシフェニル)エチル基、1-(4-トリフルオロメトキシフェニル)エチル基、

1-(2-ニトロフェニル)エチル基、1-(3-ニトロフェニル)エチル基、

1-(4-ニトロフェニル)エチル基、

1-(2-シアノフェニル)エチル基、1-(3-シアノフェニル)エチル基、

1-(4-シアノフェニル)エチル基、

1-(2-フルオロフェニル)エチル基、1-(3-フルオロフェニル)エチル基、1-(4-フルオロフェニル)エチル基、1-(3,4-ジフルオロフェニル)エチル基、1-(3,5-ジフルオロフェニル)エチル基、1-(2,6-

ジフルオロフェニル) エチル基、1-(2, 4-ジフルオロフェニル) エチル基

1-(2-クロロフェニル) エチル基、1-(3-クロロフェニル) エチル基、
1-(4-クロロフェニル) エチル基、1-(3, 4-ジクロロフェニル) エチル基、
1-(3, 5-ジクロロフェニル) エチル基、1-(2, 6-ジクロロフェニル) エチル基、
1-(2, 4-ジクロロフェニル) エチル基、
1-(2-ブロモフェニル) エチル基、1-(3-ブロモフェニル) エチル基、
1-(4-ブロモフェニル) エチル基、1-(3, 4-ジブロモフェニル) エチル基、
1-(3, 5-ジブロモフェニル) エチル基、1-(2, 6-ジブロモフェニル) エチル基、
1-(2, 4-ジブロモフェニル) エチル基、

【0037】

2-(フェニル) エチル基、
2-(2-メチルフェニル) エチル基、2-(3-メチルフェニル) エチル基、
2-(4-メチルフェニル) エチル基、
2-(2-トリフルオロメチルフェニル) エチル基、2-(3-トリフルオロメチルフェニル) エチル基、
2-(4-トリフルオロメチルフェニル) エチル基、
2-(2-メトキシフェニル) エチル基、2-(3-メトキシフェニル) エチル基、
2-(4-メトキシフェニル) エチル基、
2-(2-メチルチオフェニル) エチル基、2-(3-メチルチオフェニル) エチル基、
2-(4-メチルチオフェニル) エチル基、
2-(2-トリフルオロメトキシフェニル) エチル基、2-(3-トリフルオロメトキシフェニル) エチル基、
2-(4-トリフルオロメトキシフェニル) エチル基、
2-(2-ニトロフェニル) エチル基、2-(3-ニトロフェニル) エチル基、
2-(4-ニトロフェニル) エチル基、
2-(2-シアノフェニル) エチル基、2-(3-シアノフェニル) エチル基、
2-(4-シアノフェニル) エチル基、
2-(2-フルオロフェニル) エチル基、2-(3-フルオロフェニル) エチル基、
2-(4-フルオロフェニル) エチル基、2-(3, 4-ジフルオロフェニル) エチル基、

ル) エチル基、2-(3, 5-ジフルオロフェニル) エチル基、2-(2, 6-ジフルオロフェニル) エチル基、2-(2, 4-ジフルオロフェニル) エチル基

2-(2-クロロフェニル) エチル基、2-(3-クロロフェニル) エチル基、
2-(4-クロロフェニル) エチル基、2-(3, 4-ジクロロフェニル) エチル基、
2-(3, 5-ジクロロフェニル) エチル基、2-(2, 6-ジクロロフェニル) エチル基、
2-(2, 4-ジクロロフェニル) エチル基、
2-(2-ブロモフェニル) エチル基、2-(3-ブロモフェニル) エチル基、
2-(4-ブロモフェニル) エチル基、2-(3, 4-ジブロモフェニル) エチル基、
2-(3, 5-ジブロモフェニル) エチル基、2-(2, 6-ジブロモフェニル) エチル基、
2-(2, 4-ジブロモフェニル) エチル基、

【0038】

フェニルオキシメチル基、1-(フェニルオキシ) エチル基、2-(フェニルオキシ) エチル基、

(2-メチルフェニル) オキシメチル基、(3-メチルフェニル) オキシメチル基、
(4-メチルフェニル) オキシメチル基、

(2-トリフルオロメチルフェニル) オキシメチル基、(3-トリフルオロメチルフェニル) オキシメチル基、
(4-トリフルオロメチルフェニル) オキシメチル基、

(2-メトキシフェニル) オキシメチル基、(3-メトキシフェニル) オキシメチル基、
(4-メトキシフェニル) オキシメチル基、

(2-メチルチオフェニル) オキシメチル基、(3-メチルチオフェニル) オキシメチル基、
(4-メチルチオフェニル) オキシメチル基、

(2-トリフルオロメトキシフェニル) オキシメチル基、(3-トリフルオロメトキシフェニル) オキシメチル基、
(4-トリフルオロメトキシフェニル) オキシメチル基、

(2-ニトロフェニル) オキシメチル基、(3-ニトロフェニル) オキシメチル基、
(4-ニトロフェニル) オキシメチル基、

(2-シアノフェニル) オキシメチル基、(3-シアノフェニル) オキシメチル

基、(4-シアノフェニル)オキシメチル基、

(2-フルオロフェニル)オキシメチル基、(3-フルオロフェニル)オキシメチル基、(4-フルオロフェニル)オキシメチル基、(3,4-ジフルオロフェニル)オキシメチル基、(3,5-ジフルオロフェニル)オキシメチル基、(2,6-ジフルオロフェニル)オキシメチル基、(2,4-ジフルオロフェニル)オキシメチル基、

(2-クロロフェニル)オキシメチル基、(3-クロロフェニル)オキシメチル基、(4-クロロフェニル)オキシメチル基、(3,4-ジクロロフェニル)オキシメチル基、(3,5-ジクロロフェニル)オキシメチル基、(2,6-ジクロロフェニル)オキシメチル基、(2,4-ジクロロフェニル)オキシメチル基、

(2-ブロモフェニル)オキシメチル基、(3-ブロモフェニル)オキシメチル基、(4-ブロモフェニル)オキシメチル基、(3,4-ジブロモフェニル)オキシメチル基、(3,5-ジブロモフェニル)オキシメチル基、(2,6-ジブロモフェニル)オキシメチル基、(2,4-ジブロモフェニル)オキシメチル基、

【0039】

ベンジルオキシメチル基、

(2-メチルベンジル)オキシメチル基、(3-メチルベンジル)オキシメチル基、(4-メチルベンジル)オキシメチル基、

(2-トリフルオロメチルベンジル)オキシメチル基、(3-トリフルオロメチルベンジル)オキシメチル基、(4-トリフルオロメチルベンジル)オキシメチル基、

(2-メトキシベンジル)オキシメチル基、(3-メトキシベンジル)オキシメチル基、(4-メトキシベンジル)オキシメチル基、

(2-メチルチオベンジル)オキシメチル基、(3-メチルチオベンジル)オキシメチル基、(4-メチルチオベンジル)オキシメチル基、

(2-トリフルオロメトキシベンジル)オキシメチル基、(3-トリフルオロメトキシベンジル)オキシメチル基、(4-トリフルオロメトキシベンジル)オキシメチル基、

シメチル基、

(2-ニトロベンジル) オキシメチル基、(3-ニトロベンジル) オキシメチル基、(4-ニトロベンジル) オキシメチル基、

(2-シアノベンジル) オキシメチル基、(3-シアノベンジル) オキシメチル基、(4-シアノベンジル) オキシメチル基、

(2-フルオロベンジル) オキシメチル基、(3-フルオロベンジル) オキシメチル基、(4-フルオロベンジル) オキシメチル基、(3, 4-ジフルオロベンジル) オキシメチル基、(3, 5-ジフルオロベンジル) オキシメチル基、(2, 6-ジフルオロベンジル) オキシメチル基、(2, 4-ジフルオロベンジル) オキシメチル基、

(2-クロロベンジル) オキシメチル基、(3-クロロベンジル) オキシメチル基、(4-クロロベンジル) オキシメチル基、(3, 4-ジクロロベンジル) オキシメチル基、(3, 5-ジクロロベンジル) オキシメチル基、(2, 6-ジクロロベンジル) オキシメチル基、(2, 4-ジクロロベンジル) オキシメチル基、

(2-ブロモベンジル) オキシメチル基、(3-ブロモベンジル) オキシメチル基、(4-ブロモベンジル) オキシメチル基、(3, 4-ジブロモベンジル) オキシメチル基、(3, 5-ジブロモベンジル) オキシメチル基、(2, 6-ジブロモベンジル) オキシメチル基、(2, 4-ジブロモベンジル) オキシメチル基、

【0040】

アセチルオキシメチル基、プロピオニルオキシメチル基及び α -アセトキシベンジル基から選ばれるいずれかの基を表す。

【0041】

本発明化合物が防除効力を示す有害節足動物としては、有害昆虫や有害ダニ類等が挙げられ、具体的には例えば以下に示すものが挙げられる。

【0042】

半翅目害虫：ヒメトビウンカ(*Laodelphax striatellus*)、トビイロウンカ(*Nilaparvata lugens*)、セジロウンカ(*Sogatella furcifera*)等のウンカ類、ツマグ

ロヨコバイ (*Nephotettix cincticeps*)、チャノミドリヒメヨコバイ (*Empoasca onukii*) 等のヨコバイ類、ワタアブラムシ (*Aphis gossypii*)、モモアカアブラムシ (*Myzus persicae*) 等のアブラムシ類、カメムシ類、オンシツコナジラミ (*Trialeurodes vaporariorum*)、タバココナジラミ (*Bemisia tabaci*)、シルバーリーフコナジラミ (*Bemisia argentifolii*) 等のコナジラミ類、カイガラムシ類、ゲンバウムシ類、キジラミ類等

【0043】

鱗翅目害虫：ニカメイガ (*Chilo suppressalis*)、コブノメイガ (*Cnaphalocrocis medinalis*)、ヨーロピアンコーンボラー (*Ostrinia nubilalis*)、シバツトガ (*Parapediasia teterrella*) 等のメイガ類、ハスモンヨトウ (*Spodoptera litura*)、シロイチモジヨトウ (*Spodoptera exigua*)、アワヨトウ (*Pseudaletia separata*)、ヨトウガ (*Mamestra brassicae*)、タマナヤガ (*Agrotis ipsilon*)、トリコプルシア属 (*Trichoplusia* spp.)、ヘリオティス属 (*Heliothis* spp.)、ヘリコベルパ属 (*Helicoverpa* spp.)、エアリアス属 (*Earias* spp.) 等のヤガ類、モンシロチョウ (*Pieris rapae crucivora*) 等のシロチョウ類、リンゴコカクモンハマキ (*Adoxophyes orana fasciata*)、ナシヒメシンクイ (*Grapholita molesta*)、コドリリングモス (*Cydia pomonella*) 等のハマキガ類、モモシンクイガ (*Carpocapsa niponensis*) 等のシンクイガ類、モモハモグリガ (*Lyonetia clerkella*) 等のチビガ類、キンモンホソガ (*Phyllonorycter ringoniella*) 等のホソガ類、ミカンハモグリガ (*Phyllocnistis citrella*) 等のコハモグリガ類、コナガ (*Plutella xylostella*) 等のスガ類、ピンクボールワーム (*Pectinophora gossypiella*) 等のキバガ類、ヒトリガ類、ヒロズコガ類等

【0044】

双翅目害虫：アカイエカ (*Culex pipiens pallens*)、コガタアカイエカ (*Culex tritaeniorhynchus*)、ネツタイイエカ (*Culex quinquefasciatus*) 等のイエカ類、(*Aedes aegypti*)、(*Aedes albopictus*) 等のエーデス属、(*Anopheles sinensis*) 等のアノフェレス属、ユスリカ類、イエバエ (*Musca domestica*)、オオイエバエ (*Muscina stabulans*) 等のイエバエ類、クロバエ類、ニクバエ類、ヒメイエバエ類、タネバエ (*Delia platura*)、タマネギバエ (*Delia antiqua*)

等のハナバエ類、ミバエ類、ショウジョウバエ類、チョウバエ類、ブユ類、アブ類、サシバエ類、ハモグリバエ類等

【 0 0 4 5 】

鞘翅目害虫：ウエスタンコーンルートワーム (*Diabrotica virgifera virgifera*)、サザンコーンルートワーム (*Diabrotica undecimpunctata howardi*) 等のコーンルートワーム類、ドウガネブイブイ (*Anomala cuprea*)、ヒメコガネ (*Anomala rufocuprea*) 等のコガネムシ類、メイズウィービル (*Sitophilus zeamais*)、イネミズゾウムシ (*Lissorhoptrus oryzophilus*)、アズキゾウムシ (*Callosobruchus chinenensis*) 等のゾウムシ類、チャイロコメノゴミムシダマシ (*Tenebrio molitor*)、コクヌストモドキ (*Tribolium castaneum*) 等のゴミムシダマシ類、イネドロオイムシ (*Oulema oryzae*)、ウリハムシ (*Aulacophora femoralis*)、キスジノミハムシ (*Phyllotreta striolata*)、コロラドハムシ (*Leptinotarsa decemlineata*) 等のハムシ類、シバンムシ類、ニジュウヤホシテントウ (*Epilachna vigintioctopunctata*) 等のエピラクナ類、ヒラタキクイムシ類、ナガシンクイムシ類、カミキリムシ類、アオバアリガタハネカクシ (*Paederus fuscipes*) 等；

アザミウマ目害虫：ミナミキイロアザミウマ (*Thrips palmi*) 等のスリップス属、ミカンキイロアザミウマ (*Frankliniella occidentalis*) 等のフランクリニエラ属、チャノキイロアザミウマ (*Sciltothrips dorsalis*) 等のシルトスリップス属等のアザミウマ類、クダアザミウマ類等

【 0 0 4 6 】

膜翅目害虫：ハバチ類、アリ類、スズメバチ類等

網翅目害虫：ゴキブリ類、チャバネゴキブリ類等

直翅目害虫：バッタ類、ケラ類等

隠翅目害虫：ヒトノミ等

シラミ目害虫：ヒトジラミ等

シロアリ目害虫：シロアリ類等

ダニ目害虫：ハダニ類

【 0 0 4 7 】

本発明の有害節足動物防除剤は、本発明化合物そのものであってもよいが、通常はさらに固体担体、液体担体、ガス状担体及び／又は餌（毒餌基材）等を混合し、必要により界面活性剤、その他の製剤用補助剤を添加して、油剤、乳剤、フロアブル剤、水和剤、粒剤、粉剤、毒餌、マイクロカプセル剤、シート製剤等に製剤化されている。

これらの製剤は本発明化合物を通常0.01～95重量%含有する。

【0048】

製剤化の際に用いられる固体担体としては、例えば粘土類（カオリンクレー、珪藻土、ベントナイト、フバサミクレー、酸性白土等）、合成含水酸化珪素、タルク類、セラミック、その他の無機鉱物（セリサイト、石英、硫黄、活性炭、炭酸カルシウム等）、化学肥料（硫安、硝安、塩安等）等の微粉末あるいは粒状物があげられる。液体担体としては、例えば水、アルコール類（メタノール、エタノール、2-プロパノール、エチレングリコール等）、ケトン類（アセトン、メチルエチルケトン、メチルイソブチルケトン、シクロヘキサノン等）、芳香族炭化水素類（トルエン、キシレン、エチルベンゼン、メチルナフタレン等）、脂肪族炭化水素類（ヘキサン、シクロヘキサン、灯油、軽油等）、エステル類（酢酸エチル、酢酸ブチル等）、ニトリル類（アセトニトリル、イソブチロニトリル等）、エーテル類（エチレングリコールジメチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、1,4-ジオキサン、テトラヒドロフラン等）、酸アミド類（N,N-ジメチルホルムアミド、N,N-ジメチルアセトアミド等）、ハロゲン化炭化水素類（ジクロロメタン、トリクロロエタン等）、ジメチルスルホキシド及び植物油（大豆油、綿実油等）があげられる。

ガス状担体としては、例えばフルオロカーボン、ブタンガス、LPG（液化石油ガス）、ジメチルエーテル及び二酸化炭素があげられる。

【0049】

界面活性剤としては、例えばアルキル硫酸エステル塩、アルキルスルホン酸塩、アルキルアリールスルホン酸塩、アルキルアリールエーテル類及びそのポリオキシエチレン化物、ポリエチレングリコールエーテル類、多価アルコールエステル類並びに糖アルコール誘導体があげられる。

【0050】

その他の製剤用補助剤としては、固着剤、分散剤及び安定剤等、具体的には例えばカゼイン、ゼラチン、糖類（でんぷん、アラビアガム、セルロース誘導体、アルギン酸等）、リグニン誘導体、合成水溶性高分子（ポリビニルアルコール、ポリビニルピロリドン、ポリアクリル酸類等）、PAP（酸性りん酸イソプロピル）、BHT（2, 6-ジ-tert-ブチル-4-メチルフェノール）、BHA（2-tert-ブチル-4-メトキシフェノールと3-tert-ブチル-4-メトキシフェノールとの混合物）、鉱物油、脂肪酸及び脂肪酸エステルがあげられる。

【0051】

毒餌の基材としては、例えば穀物粉、植物油、糖、結晶セルロース等の餌成分が挙げられる。毒餌には必要に応じて、ジブチルヒドロキシルエン、ノルジヒドログアイアレチン酸等の酸化防止剤、デヒドロ酢酸等の保存料、トウガラシ粉末等の子どもやペットによる誤食防止剤、チーズ香料、タマネギ香料、ピーナッツオイル等の害虫誘引性香料等が添加される。

【0052】

本発明の有害生物防除方法は、通常本発明の有害節足動物防除剤を有害節足動物に直接及び／又は有害節足動物の生息場所（巣、植物体、土壌等）に施用することにより行われる。

【0053】

本発明の有害節足動物防除剤を農林業分野の有害節足動物防除に用いる場合、その施用量は、 1000 m^2 あたりの本発明化合物の量で通常0.1～10000 gである。本発明の有害節足動物防除剤が乳剤、フロアブル剤、水和剤、マイクロカプセル剤等に製剤化されている場合は、本発明化合物濃度が通常0.01～10000 ppmとなるように水で希釈して散布することにより施用する。本発明の有害節足動物防除剤が油剤、粒剤、粉剤等に製剤化されている場合は、通常そのまま施用する。

本発明の有害節足動物防除剤は、有害節足動物に直接又は有害節足動物から保護すべき作物等の植物に散布したり、有害節足動物から保護すべき作物等の植物

の株元に施用してもよく、また、土壤に施用することにより土壤に生息する有害節足動物を防除することもできる。さらに、シート製剤の形態の本発明の有害節足動物防除剤を植物に巻き付けたり、植物の近傍に設置したり、株元の土壤表面に敷くなどの方法で施用することもできる。

【0054】

本発明の有害節足動物防除剤を防疫分野の有害節足動物の防除に用いる場合、その施用量は面上に処理するときは適用面積 1 m^2 あたりの本発明化合物量で通常 $0.001 \sim 100\text{ mg}$ であり、空間に処理するときは適用空間 1 m^3 あたりの本発明化合物量で通常 $0.001 \sim 10\text{ mg}$ である。本発明の有害節足動物防除剤が乳剤、フロアブル剤、水和剤、マイクロカプセル剤等に製剤化されている場合は本発明化合物濃度が通常 $0.01 \sim 100000\text{ ppm}$ となるように水で希釈して施用する。本発明の有害節足動物防除剤が油剤、エアゾール、燻煙剤、毒餌等に製剤化されている場合は通常そのまま施用する。

【0055】

また、本発明の有害節足動物防除剤は他の殺虫剤、殺線虫剤、殺ダニ剤、殺菌剤、除草剤、植物生長調節剤、共力剤、肥料、土壤改良剤、動物用飼料等と共に用いることもできる。

【0056】

かかる殺虫剤、殺ダニ剤及び殺線虫剤としては、例えばフェニトロチオン、フェンチオン、ピリダフェンチオン、ダイアジノン、クロルピリホス、クロルピリホスメチル、アセフェート、メチダチオン、ジスルホトン、DDVP、スルプロホス、プロフェノホス、シアノホス、ジオキサベンゾホス、ジメトエート、フェントエート、マラチオン、トリクロルホン、アジンホスメチル、モノクロトホス、ジクロトホス、エチオン、ホスチアゼート等の有機リン系化合物、

BPMC、ベンフラカルブ、プロボキスル、カルボスルファン、カルバリル、メソミル、エチオフェンカルブ、アルジカルブ、オキサミル、フェノチオカルブ、チオジカルブ等のカーバメート系化合物、

【0057】

エトフェンプロックス、フェンバレレート、エスフェンバレレート、フェンプロパトリン、シペルメトリン、 α -シペルメトリン、Z-シペルメトリン、ペルメトリン、シハロトリン、 μ -シハロトリン、シフルトリン、 β -シフルトリン、デルタメトリン、シクロプロスリン、 ϵ -フルバリネート、フルシトリネート、ピフェンスリン、アクリナスリン、トラロメスリン、シラフルオフエン、ハルフェンプロックス等のピレスロイド化合物、

【0058】

アセタミプリド、チアメトキサム、チアクロプリド等のネオニコチノイド化合物、クロルフルアズロン、テフルベンズロン、フルフェノクスロン、ルフェニュロン等のベンゾイルフェニルウレア系化合物、テブフェノジド、ハロフェノジド、メトキシフェノジド、クロマフェノジド等のベンゾイルヒドラジド化合物、ブプロフェジン等のチアジアジン誘導体、カルタップ、チオシクラム、ベンスルタップ等のネライストキシシン誘導体、エンドスルファン、 γ -BHC、1, 1-ビス(クロロフェニル)-2, 2, 2-トリクロロエタノール等の塩素化炭化水素化合物、アミトラズ、クロルジメホルム等のホルムアミジン誘導体、ジアフェンチウロン等のチオ尿素誘導体、エチプロール、アセトプロール等のフェニルピラゾール系化合物、クロルフェナピル、ピメトロジン、スピノサド、インドキサカルブ、プロモプロピレート、テトラジホン、キノメチオネート、プロパルゲイト、フェンブタティンオキシド、ヘキシチアゾクス、エトキサゾール、クロフェンテジン、ピリダベン、ピリダリル、フェンピロキシメート、テブフェンピラド、ピリミジフェン、フェナザキン、アセキノシル、ピフェナゼート、フルアクリピリム、スピロジクロフェン、スピロメシフェン、ミルベメクチン、アヴェエルメクチン、エマメクチン安息香酸塩、アザジラクチン、ポリナクチンコンプレックス〔テトラナクチン、ジナクチン、トリナクチン〕等があげられる。

【0059】

【実施例】

以下、本発明を製造例、製剤例および試験例等によりさらに詳しく説明するが、本発明はこれらの例に限定されるものではない。

なお、製造例中、 ^1H -NMRのデータは、重クロロホルム中、テトラメチル

シランを内部標準として測定したものを示す。

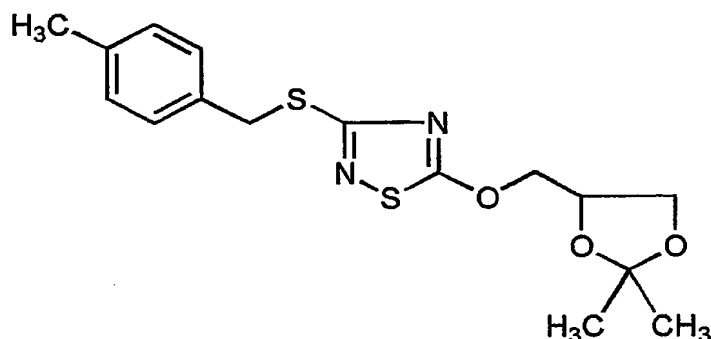
【0060】

まず、本発明化合物の製造法につき、製造例を示す。

製造例 1

N, N-ジメチルホルムアミド 2 g に 5-クロロ-3-(4-メチルベンジル)チオ-1, 2, 4-チアジアゾール 0.257 g 及び 2, 2-ジメチル-1, 3-ジオキサラン-4-メタノール 0.145 g を溶解し、約 0℃ で水素化ナトリウム (60%油性) 48 mg を加え、約 0℃ で 30 分間、室温で 4 時間攪拌した。その後、反応混合物を飽和食塩水に注加し、tert-ブチルメチルエーテルで抽出した。有機層を濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付して 5-(2, 2-ジメチル-1, 3-ジオキサラン-4-イル)メトキシ-3-(4-メチルベンジル)チオ-1, 2, 4-チアジアゾール 0.27 g を得た。

5-(2, 2-ジメチル-1, 3-ジオキサラン-4-イル)メトキシ-3-(4-メチルベンジル)チオ-1, 2, 4-チアジアゾール (以下、本発明化合物 1 と記す。)



$^1\text{H-NMR}$: 7.29 (d, 2H) 7.11 (d, 2H) 4.54-4.44 (m, 3H) 4.37 (d, 2H) 4.15-4.11 (m, 1H) 3.83-3.80 (m, 1H) 2.32 (s, 3H) 1.45 (s, 3H) 1.38 (s, 3H)

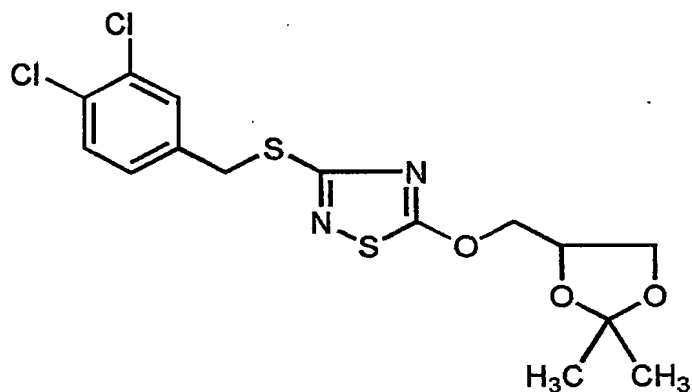
【0061】

製造例 2

N, N-ジメチルホルムアミド 2 g に後記参考製造例 8 により製造した 5-ク

クロロ-3-(3,4-ジクロロベンジル)チオ-1,2,4-チアジアゾールの粗成生物 312 mg 及び 2,2-ジメチル-1,3-ジオキサラン-4-メタノール 0.145 g を溶解し、約 0℃ で水素化ナトリウム (60%油性) 48 mg を加え約 0℃ で 30 分間、室温で 4 時間攪拌した。その後、反応混合物を飽和食塩水に注加し、tert-ブチルメチルエーテルで抽出した。有機層を濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付して 5-(2,2-ジメチル-1,3-ジオキサラン-4-イル)メトキシ-3-(3,4-ジクロロベンジル)チオ-1,2,4-チアジアゾール 120 mg を得た。

5-(2,2-ジメチル-1,3-ジオキサラン-4-イル)メトキシ-3-(3,4-ジクロロベンジル)チオ-1,2,4-チアジアゾール (以下、本発明化合物 2 と記す。)



$^1\text{H-NMR}$: 7.55 (s, 1H) 7.36 (d, 1H) 7.26-7.22 (m, 1H) 4.55-4.44 (m, 3H) 4.31 (s, 2H) 4.15-4.09 (m, 1H) 3.84-3.80 (m, 1H) 1.45 (s, 3H) 1.38 (s, 3H)

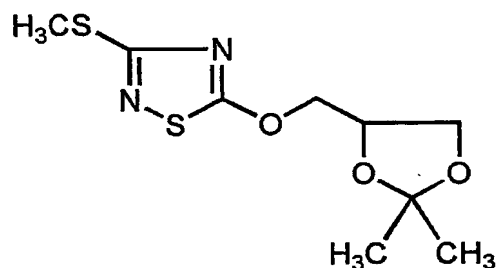
【0062】

製造例 3

N,N-ジメチルホルムアミド 40 ml に後記参考製造例 1 により製造した 5-クロロ-3-メチルチオ-1,2,4-チアジアゾール 3.34 g 及び 2,2-ジメチル-1,3-ジオキサラン-4-メタノール 2.90 g を溶解し、約 0℃ で水素化ナトリウム (60%油性) 880 mg を加え、同温で 1 時間攪拌した。その後、反応混合物を飽和食塩水に注加し、tert-ブチルメチルエーテル

で抽出した。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥し、濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付して5-(2,2-ジメチル-1,3-ジオキサラン-4-イル)メトキシ-3-メチルチオ-1,2,4-チアジアゾール4.67gを得た。

5-(2,2-ジメチル-1,3-ジオキサラン-4-イル)メトキシ-3-メチルチオ-1,2,4-チアジアゾール(以下、本発明化合物3と記す。)



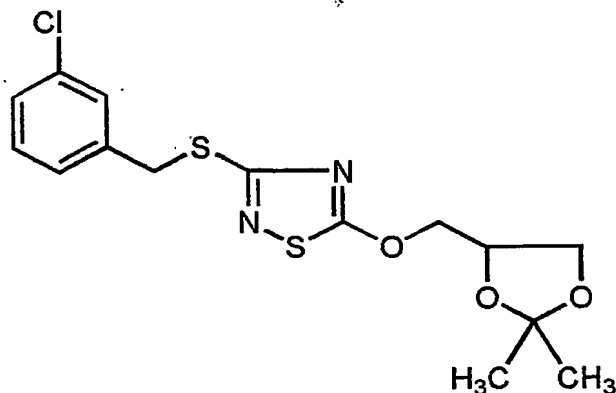
$^1\text{H-NMR}$: 4.57-4.46 (m, 3H) 4.16-4.09 (m, 1H) 3.85-3.81 (m, 1H) 2.60 (s, 3H) 1.45 (s, 3H) 1.35 (s, 3H)

【0063】

製造例4

N,N-ジメチルホルムアミド2mlに後記参考製造例6により製造した5-クロロ-3-(3-クロロベンジル)チオ-1,2,4-チアジアゾールの粗生成物300mg及び2,2-ジメチル-1,3-ジオキサラン-4-メタノール157mgを溶解し、水素化ナトリウム(60%油性)52mgを加え室温で2時間攪拌した。その後、反応混合物を飽和食塩水に注加し、tert-ブチルメチルエーテルで抽出した。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付して5-(2,2-ジメチル-1,3-ジオキサラン-4-イル)メトキシ-3-(3-クロロベンジル)チオ-1,2,4-チアジアゾール150mgを得た。

5-(2,2-ジメチル-1,3-ジオキサラン-4-イル)メトキシ-3-(3-クロロベンジル)チオ-1,2,4-チアジアゾール(以下、本発明化合物4と記す。)



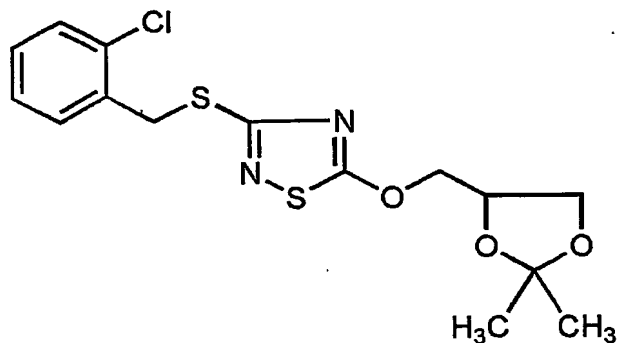
$^1\text{H-NMR}$: 7.42 (s, 1H) 7.31–7.22 (m, 2H) 4.54–4.45 (m, 3H) 4.35 (s, 2H) 4.16–4.11 (m, 1H) 3.85–3.81 (m, 1H) 1.45 (s, 3H) 1.38 (s, 3H)

【0064】

製造例 5

N, N-ジメチルホルムアミド 2 ml に後記参考製造例 5 により製造した 5-クロロ-3-(2-クロロベンジル)チオ-1, 2, 4-チアジアゾールの粗生成物 300 mg 及び 2, 2-ジメチル-1, 3-ジオキサラン-4-メタノール 157 mg を溶解し、水素化ナトリウム (60%油性) 52 mg を加え室温で 2 時間攪拌した。その後、反応混合物を飽和食塩水に注加し、tert-ブチルメチルエーテルで抽出した。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥し、濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付して 5-(2, 2-ジメチル-1, 3-ジオキサラン-4-イル)メトキシ-3-(2-クロロベンジル)チオ-1, 2, 4-チアジアゾール 140 mg を得た。

5-(2, 2-ジメチル-1, 3-ジオキサラン-4-イル)メトキシ-3-(2-クロロベンジル)チオ-1, 2, 4-チアジアゾール (以下、本発明化合物 5 と記す。)

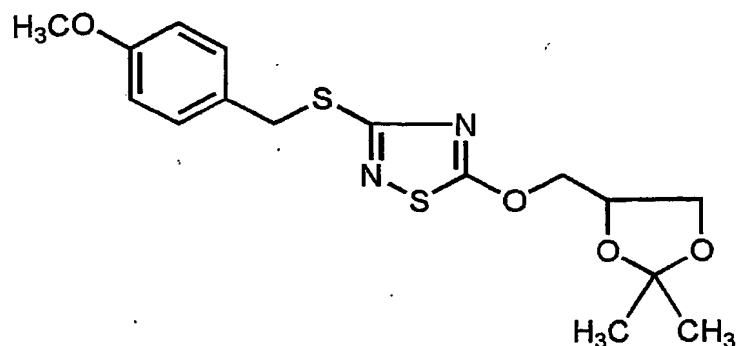


$^1\text{H-NMR}$: 7.56 (m, 1H) 7.37 (m, 1H) 7.20 (m, 2H) 4.56-4.45 (m, 5H) 4.15-4.11 (m, 1H) 3.84-3.80 (m, 1H) 1.45 (s, 3H) 1.38 (s, 3H)

【0065】

製造例6

N, N-ジメチルホルムアミド 2 ml に後記参考製造例4により製造した5-クロロ-3-(4-メトキシベンジル)チオ-1, 2, 4-チアジアゾール 200 mg 及び 2, 2-ジメチル-1, 3-ジオキサラン-4-メタノール 153 mg を溶解し、約 0℃ で水素化ナトリウム (60%油性) 35 mg を加え、約 0℃ で 15 分間、室温で 2 時間攪拌した。その後、反応混合物を飽和食塩水に注加し、tert-ブチルメチルエーテルで抽出した。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥し、濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付して 5-(2, 2-ジメチル-1, 3-ジオキサラン-4-イル)メトキシ-3-(4-メトキシベンジル)チオ-1, 2, 4-チアジアゾール 200 mg を得た。5-(2, 2-ジメチル-1, 3-ジオキサラン-4-イル)メトキシ-3-(4-メトキシベンジル)チオ-1, 2, 4-チアジアゾール (以下、本発明化合物 6 と記す。)



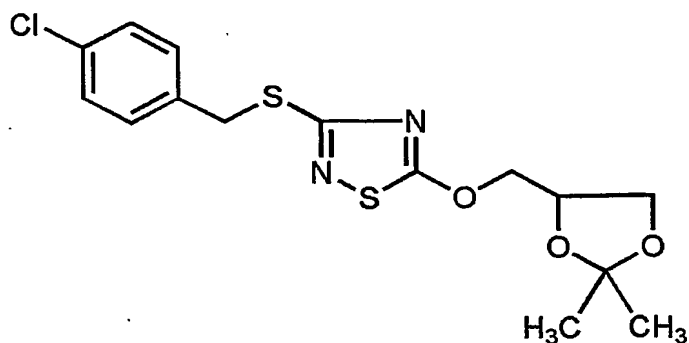
$^1\text{H-NMR}$: 7.33 (d, 2H) 6.84 (d, 2H) 4.54-4.46 (m, 3H) 4.36 (s, 2H) 4.15-4.13 (m, 1H) 3.84-3.79 (m, 4H) 1.45 (s, 3H) 1.38 (s, 3H)

【0066】

製造例7

N, N-ジメチルホルムアミド3mlに後記参考製造例3により製造した5-クロロ-3-(4-クロロベンジル)チオ-1, 2, 4-チアジアゾールの粗成生物416mg及び2, 2-ジメチル-1, 3-ジオキサラン-4-メタノール198mgを溶解し、約0℃で水素化ナトリウム(60%油性)72mgを加え、同温で約1時間攪拌した。その後、反応混合物を飽和食塩水に注加し、tert-ブチルメチルエーテルで抽出した。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥し、濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付して5-(2, 2-ジメチル-1, 3-ジオキサラン-4-イル)メトキシ-3-(4-クロロベンジル)チオ-1, 2, 4-チアジアゾール460mgを得た。

5-(2, 2-ジメチル-1, 3-ジオキサラン-4-イル)メトキシ-3-(4-クロロベンジル)チオ-1, 2, 4-チアジアゾール(以下、本発明化合物7と記す。)



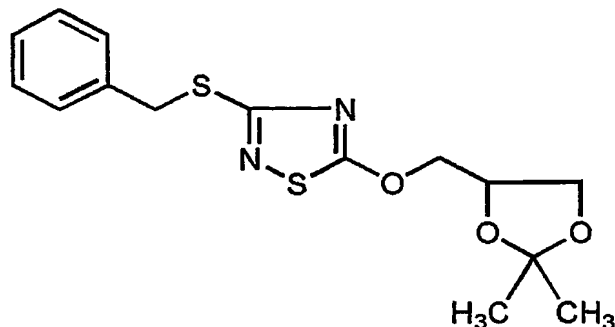
$^1\text{H-NMR}$: 7.36 (d, 2H) 7.27 (d, 2H) 4.55-4.44 (m, 2H) 4.35 (s, 2H) 4.17-4.10 (m, 1H) 3.84-3.81 (s, 1H) 1.47 (s, 3H) 1.38 (s, 3H)

【0067】

製造例 8

N, N-ジメチルホルムアミド 5 ml に後記参考製造例 2 により製造した 5-クロロ-3-ベンジルチオ-1, 2, 4-チアジアゾール 340 mg 及び 2, 2-ジメチル-1, 3-ジオキソラン-4-メタノール 222 mg を溶解し、約 0℃ で水素化ナトリウム (60% 油性) 84 mg を加えた後、室温で約 1 時間攪拌した。その後、反応混合物を飽和食塩水に注加し、tert-ブチルメチルエーテルで抽出した。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥し、濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付して 5-(2, 2-ジメチル-1, 3-ジオキソラン-4-イル) メトキシ-3-ベンジルチオ-1, 2, 4-チアジアゾール 370 mg を得た。

5-(2, 2-ジメチル-1, 3-ジオキソラン-4-イル) メトキシ-3-ベンジルチオ-1, 2, 4-チアジアゾール (以下、本発明化合物 8 と記す。)



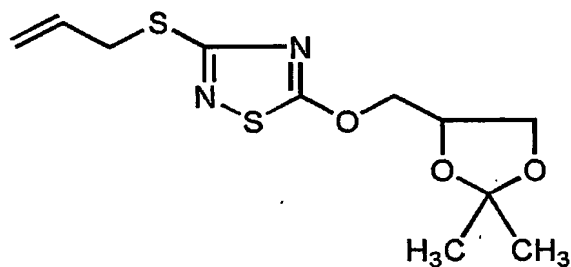
$^1\text{H-NMR}$: 7.42 (d, 2H) 7.34-7.24 (m, 3H) 4.55-4.43 (m, 3H) 4.40 (s, 2H) 4.15-4.12 (m, 1H) 3.84-3.81 (m, 1H) 1.45 (s, 3H) 1.35 (s, 3H)

【0068】

製造例9

N, N-ジメチルホルムアミド4gに後記参考製造例10により製造した5-クロロ-3-アリルチオ-1, 2, 4-チアジアゾール386mg及び2, 2-ジメチル-1, 3-ジオキサラン-4-メタノール277mgを溶解し、氷冷下で水素化ナトリウム(60%油性)88mgを加えた。氷冷下で1時間攪拌した後、反応混合物を飽和食塩水に注加し、tert-ブチルメチルエーテルで抽出した。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥し、濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付して5-(2, 2-ジメチル-1, 3-ジオキサラン-4-イル)メトキシ-3-アリルチオ-1, 2, 4-チアジアゾール530mgを得た。

5-(2, 2-ジメチル-1, 3-ジオキサラン-4-イル)メトキシ-3-アリルチオ-1, 2, 4-チアジアゾール(以下、本発明化合物9と記す。)



$^1\text{H-NMR}$: 5.96 (m, 1H) 5.32 (d, 1H) 5.15 (d, 1H) 4.51 (m, 3H) 4.13 (m, 1H) 3.84 (m, 3H) 1.45 (s, 3H) 1.36 (s, 3H)

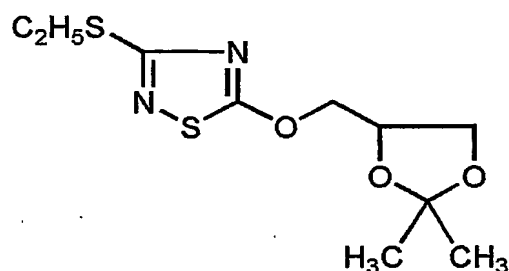
【0069】

製造例10

N, N-ジメチルホルムアミド4mlに後記参考製造例7により製造した5-クロロ-3-エチルチオ-1, 2, 4-チアジアゾール362mg及び2, 2-

ジメチル-1, 3-ジオキソラン-4-メタノール 264 mg を溶解し、約 0℃ で水素化ナトリウム (60%油性) 88 mg を加え、同温で 30 分攪拌した。その後、反応混合物を飽和食塩水に注加し、tert-ブチルメチルエーテルで抽出した。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥し、濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付して 5-(2, 2-ジメチル-1, 3-ジオキソラン-4-イル) メトキシ-3-エチルチオ-1, 2, 4-チアジアゾール 410 mg を得た。

5-(2, 2-ジメチル-1, 3-ジオキソラン-4-イル) メトキシ-3-エチルチオ-1, 2, 4-チアジアゾール (以下、本発明化合物 10 と記す。)



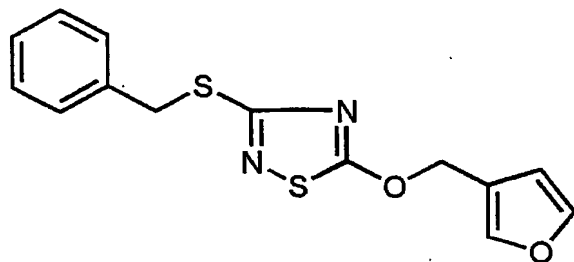
$^1\text{H-NMR}$: 4.51 (m, 3H) 4.14 (m, 1H) 3.84 (m, 1H) 3.17 (q, 2H) 1.41 (m, 9H)

【0070】

製造例 11

N, N-ジメチルホルムアミド 2 g に 5-クロロ-3-ベンジルチオ-1, 2, 4-チアジアゾール 0.243 g 及び 3-フランメタノール 0.098 g を溶解し、約 0℃ で水素化ナトリウム (60%油性) 0.045 g を加え、約 0℃ で 1 時間、さらに室温で 2 時間攪拌した。その後、反応混合物を飽和食塩水に注加し、tert-ブチルメチルエーテルで抽出した。有機層を濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付して、5-(3-フリル) メトキシ-3-ベンジルチオ-1, 2, 4-チアジアゾール 0.17 g を得た。

5-(3-フリル) メトキシ-3-ベンジルチオ-1, 2, 4-チアジアゾール (以下、本発明化合物 11 と記す。)



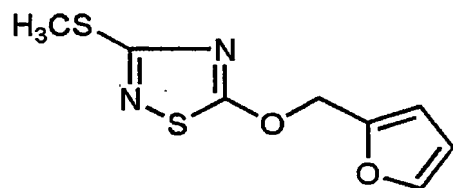
$^1\text{H-NMR}$: 7.56 (s, 1H) 7.42 (m, 3H) 7.30 (m, 3H) 6.50 (s, 1H) 5.37 (s, 2H) 4.41 (s, 2H)

【0071】

製造例 12

N, N-ジメチルホルムアミド 4 ml に 5-クロロ-3-メチルチオ-1, 2, 4-チアジアゾール 0.334 g 及び 2-フランメタノール 0.196 g を溶解し、約 0℃ で水素化ナトリウム (60% 油性) 0.084 g を加え、約 0℃ で 0.5 時間、さらに室温で 4 時間攪拌した。その後、反応混合物を飽和食塩水に注加し、tert-ブチルメチルエーテルで抽出した。有機層を濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付して、5-(2-フリル)メトキシ-3-メチルチオ-1, 2, 4-チアジアゾール 0.25 g を得た。

5-(2-フリル)メトキシ-3-メチルチオ-1, 2, 4-チアジアゾール (以下、本発明化合物 12 と記す。)



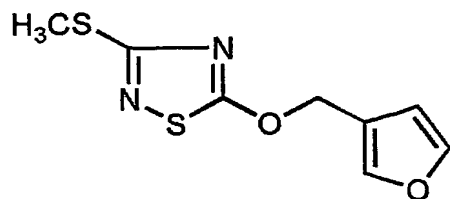
$^1\text{H-NMR}$: 7.47 (m, 1H) 6.56 (m, 1H) 6.40 (m, 1H) 5.45 (s, 2H) 2.62 (s, 3H)

【0072】

製造例 13

2-フランメタノールの代わりに 3-フランメタノール 0.196 g を用いた以外は製造例 12 と同様にして 5-(3-フリル)メトキシ-3-メチルチオ-1, 2, 4-チアジアゾール 390 mg を得た。

5-(3-フリル)メトキシ-3-メチルチオ-1, 2, 4-チアジアゾール(以下、本発明化合物13と記す。)



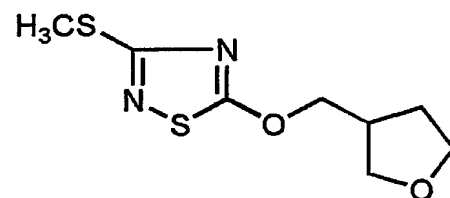
$^1\text{H-NMR}$: 7.58 (s, 1H) 7.43 (d, 1H) 6.51 (d, 1H) 5.38 (s, 2H) 2.62 (s, 3H)

【0073】

製造例14

2-フランメタノールの代わりにテトラヒドロ-3-フランメタノール204mgを用いた以外は製造例12と同様にして5-(テトラヒドロ-3-フリル)メトキシ-3-メチルチオ-1, 2, 4-チアジアゾール406mgを得た。

5-(テトラヒドロ-3-フリル)メトキシ-3-メチルチオ-1, 2, 4-チアジアゾール(以下、本発明化合物14と記す。)



$^1\text{H-NMR}$: 4.49-4.36 (m, 2H) 3.93-3.65 (m, 4H) 2.84-2.74 (m, 1H) 2.60 (s, 3H) 2.17-2.05 (m, 1H) 1.76-1.65 (m, 1H)

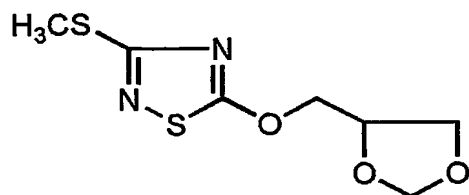
【0074】

製造例15

N, N-ジメチルホルムアミド10mlに3-メチルチオ-5-クロロ-1, 2, 4-チアジアゾール835mg及びグリセロールホルマール520mgを溶解し、約0℃で水素化ナトリウム(60%油性)204mgを加え、約0℃で20分間、室温で30分間攪拌した。その後、反応混合物を飽和食塩水に加え、t-ブチルメチルエーテルで抽出した。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥した後

、濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル＝20：1）、次いで分取HPLCに付して5-（1，3-ジオキサラン-4-イル）メトキシ-3-メチルチオ-1，2，4-チアジアゾール250 mgを得た。

5-（1，3-ジオキサラン-4-イル）メトキシ-3-メチルチオ-1，2，4-チアジアゾール（以下、本発明化合物15と記す。）

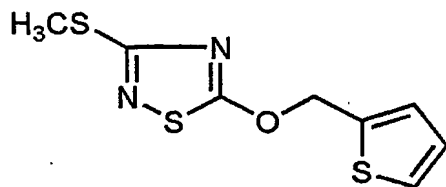


$^1\text{H-NMR}$: 5.08 (s, 1H) 4.93 (s, 1H) 4.55-4.45 (m, 3H) 4.06-4.02 (m, 1H) 3.82-3.78 (m, 1H) 2.60 (s, 3H)

【0075】

製造例16

N，N-ジメチルホルムアミド4 mlに5-クロロ-3-メチルチオ-1，2，4-チアジアゾール0.334 g及び2-チオフェンメタノール228 mgを溶解し、約0℃で水素化ナトリウム（60%油性）0.084 gを加え、約0℃で0.5時間、さらに室温で4時間攪拌した。その後、反応混合物を飽和食塩水に注加し、tert-ブチルメチルエーテルで抽出した。有機層を濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付して、5-（2-チエニル）メトキシ-3-メチルチオ-1，2，4-チアジアゾール66 mgを得た。
5-（2-チエニル）メトキシ-3-メチルチオ-1，2，4-チアジアゾール（以下、本発明化合物16と記す。）



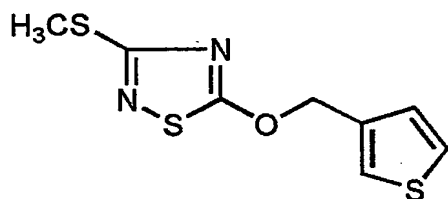
$^1\text{H-NMR}$: 7.38 (d, 1H) 7.25 (d, 1H) 7.22 (m,

^1H) 5.65 (s, 2H) 2.62 (s, 3H)

【0076】

製造例 17

N, N-ジメチルホルムアミド 4 ml に 5-クロロ-3-メチルチオ-1, 2, 4-チアジアゾール 0.334 g 及び 3-チオフエンメタノール 228 mg を溶解し、約 0℃ で水素化ナトリウム (60% 油性) 0.084 g を加え、約 0℃ で 0.5 時間、さらに室温で 4 時間攪拌した。その後、反応混合物を飽和食塩水に注加し、tert-ブチルメチルエーテルで抽出した。有機層を濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付して、5-(3-チエニル)メトキシ-3-メチルチオ-1, 2, 4-チアジアゾール 5.00 mg を得た。5-(3-チエニル)メトキシ-3-メチルチオ-1, 2, 4-チアジアゾール (以下、本発明化合物 17 と記す。)



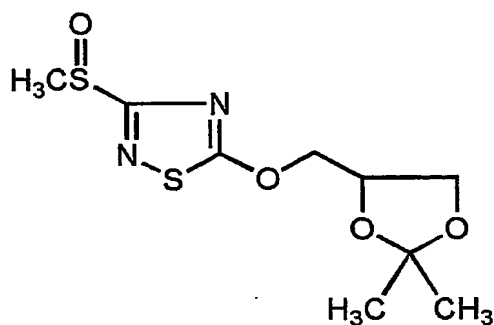
^1H -NMR: 7.43 (m, 1H) 7.35 (m, 1H) 7.17 (m, 1H) 5.49 (s, 2H) 2.61 (s, 3H)

【0077】

製造例 18

(1) クロホルム 90 ml に 5-(2,2-ジメチル-1,3-ジオキサラン-4-イル)メトキシ-3-メチルチオ-1,2,4-チアジアゾール 4.67 g を溶解し、約 0℃ で 3-クロロ過安息香酸 (純度 70%) 3.92 g を少量ずつに分けて徐々に加え攪拌した。その後、反応混合物を飽和亜硫酸ナトリウム水溶液に注加し、クロホルムで抽出した。有機層を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、飽和食塩水で順次洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付して、5-(2,2-ジメチル-1,3-ジオキサラン-4-イル)メトキシ-3-メタンスルフィニル-1,2,4-チアジアゾール 3.87 g を得た。

5-(2,2-ジメチル-1,3-ジオキサラン-4-イル)メトキシ-3-メ
タンスルフィニル-1,2,4-チアジアゾール

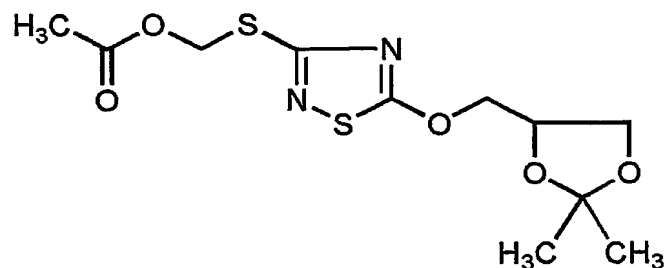


$^1\text{H-NMR}$: 4.67-4.49 (m, 3H) 4.18-4.14 (m, 1H) 3.86-3.32 (m, 1H) 2.30 (s, 3H) 1.46 (s, 3H) 1.39 (s, 3H)

【0078】

(2) 5-(2,2-ジメチル-1,3-ジオキサラン-4-イル)メトキシ-3-メタンスルフィニル1,2,4-チアジアゾール3.87gに約0℃で2,6-ルチジン2.97g、無水酢酸11.3g及びトリフルオロ酢酸無水物4.38gを加えて混合し、室温で3日間放置した。その後、反応混合物を減圧下濃縮してから、飽和炭酸水素ナトリウム水溶液に注加した。これをtert-ブチルメチルエーテルで抽出した。有機層を濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、5-(2,2-ジメチル-1,3-ジオキサラン-4-イル)メトキシ-3-(アセチルオキシメチル)チオ-1,2,4-チアジアゾール0.18gを得た。

5-(2,2-ジメチル-1,3-ジオキサラン-4-イル)メトキシ-3-(アセチルオキシメチル)チオ-1,2,4-チアジアゾール(以下、本発明化合物18と記す。)



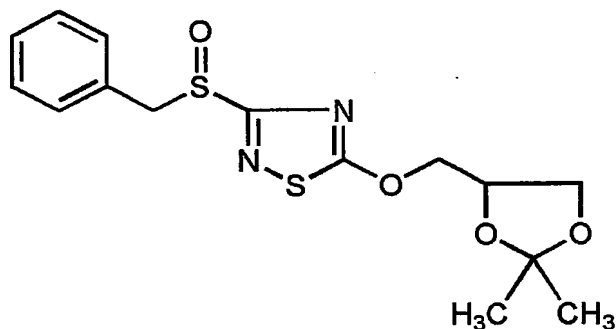
$^1\text{H-NMR}$: 5.75 (s, 2H) 4.57-4.47 (m, 3H) 4.17-4.13 (m, 1H) 3.85-3.82 (m, 1H) 2.11 (s, 3H) 1.45 (s, 3H) 1.39 (s, 3H)

【0079】

製造例19

(1) クロホルム4 ml に5-(2, 2-ジメチル-1, 3-ジオキサラン-4-イル)メトキシ-3-ベンジルチオ-1, 2, 4-チアジアゾール370 mg を溶解し、氷冷下で3-クロロ過安息香酸(純度70%)269 mg を少量ずつに分けて徐々に加え攪拌した。その後、反応混合物を飽和亜硫酸ナトリウム水溶液に注加し、クロホルムで抽出した。有機層を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液、飽和食塩水で順次洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付して、5-(2, 2-ジメチル-1, 3-ジオキサラン-4-イル)メトキシ-3-フェニルスルフィニル-1, 2, 4-チアジアゾール360 mg を得た。

5-(2, 2-ジメチル-1, 3-ジオキサラン-4-イル)メトキシ-3-フェニルスルフィニル-1, 2, 4-チアジアゾール



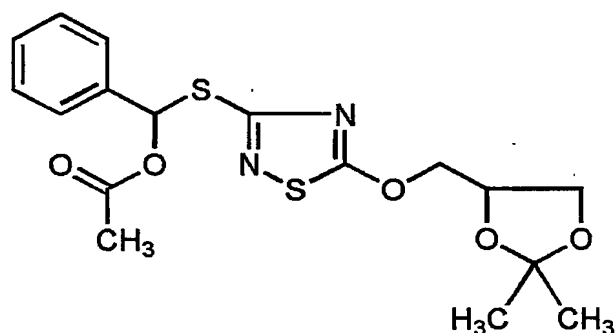
$^1\text{H-NMR}$: 7.33-7.19 (m, 5H) 4.66-4.48 (m, 3H) 4.42 (d, 1H) 4.34 (d, 1H) 4.18-4.14 (m, 1H) 3.86-3.82 (m, 1H) 1.47 (s, 3H) 1.40 (s, 3H)

【0080】

(2) 5-(2, 2-ジメチル-1, 3-ジオキサラン-4-イル)メトキシ-3-フェニルスルフィニル-1, 2, 4-チアジアゾール80 g に約0℃で酢酸

ナトリウム100mg、無水酢酸2mlを加えて混合し、14時間加熱還流した。その後、反応混合物を飽和炭酸水素ナトリウム水溶液に注加した。これをtert-ブチルメチルエーテルで抽出した。有機層を濃縮して得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィーに付し、5-(2,2-ジメチル-1,3-ジオキサラン-4-イル)メトキシ-3-(α -アセチルオキシベンジル)チオ-1,2,4-チアジアゾール28mgを得た。

5-(2,2-ジメチル-1,3-ジオキサラン-4-イル)メトキシ-3-(α -アセチルオキシベンジル)チオ-1,2,4-チアジアゾール(以下、本発明化合物19と記す。)



$^1\text{H-NMR}$: 7.74-7.73 (m, 1H) 7.53-7.51 (m, 2H) 7.41-7.35 (m, 3H) 4.58-4.32 (m, 3H) 4.20-4.07 (m, 1H) 3.86-3.73 (m, 1H) 2.10 (s, 3H) 1.46 (s, 3H) 1.39 (s, 3H)

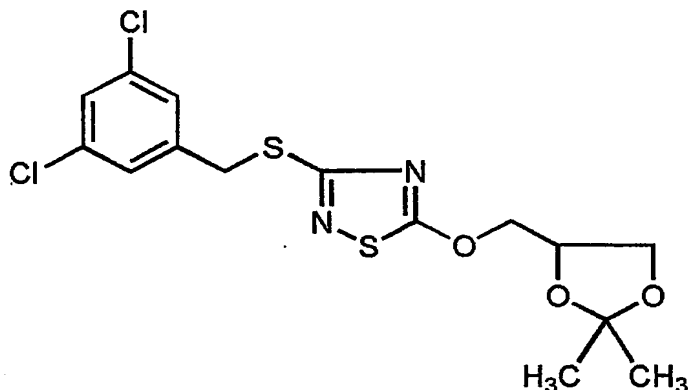
【0081】

製造例20

N,N-ジメチルホルムアミド3gに後記参考製造例11により製造した5-クロロ-3-(3,5-ジクロロベンジル)チオ-1,2,4-チアジアゾールの粗成生物468mgと2,2-ジメチル-1,3-ジオキサラン-4-メタノール198mgとを溶解し、ここに約0℃で水素化ナトリウム(60%油性)42mgを加え、30分間攪拌した。その後、反応混合物にtert-ブチルメチルエーテル及び飽和食塩水を加え、分液した。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥した後、濃縮して得られた残渣をカラムクロマトグラフィーに付し5-(2,2-ジメチル-1,3-ジオキサラン-4-イル)メトキシ-3-(3,5-ジクロ

ロベンジル)チオ-1, 2, 4-チアジアゾール72mgを得た。

5-(2, 2-ジメチル-1, 3-ジオキサラン-4-イル)メトキシ-3-(3, 5-ジクロロベンジル)チオ-1, 2, 4-チアジアゾール(以下、本発明化合物20と記す。)



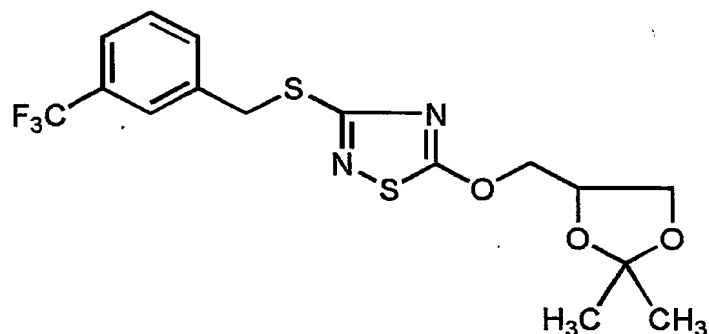
$^1\text{H-NMR}$: 7.32 (s, 2H) 7.24 (s, 1H) 4.54-4.43 (m, 3H) 4.30 (s, 2H) 4.15-4.11 (m, 1H) 3.84-3.81 (m, 1H) 1.48 (s, 3H) 1.41 (s, 3H)

【0082】

製造例21

N, N-ジメチルホルムアミド2gに後記参考製造例12により製造した5-クロロ-3-(3-トリフルオロメチルベンジル)チオ-1, 2, 4-チアジアゾールの300mgと2, 2-ジメチル-1, 3-ジオキサラン-4-メタノール127mgとを溶解し、約0℃で水素化ナトリウム(60%油性)42mgを加え、約0℃で30分間、室温で2時間攪拌した。その後、反応混合物にt-ブチルメチルエーテル及び飽和食塩水を加え、分液した。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥し、濃縮して得られた残渣をカラムクロマトグラフィーに付し5-(2, 2-ジメチル-1, 3-ジオキサラン-4-イル)メトキシ-3-(3-トリフルオロメチルベンジル)チオ-1, 2, 4-チアジアゾール370mgを得た。

5-(2, 2-ジメチル-1, 3-ジオキサラン-4-イル)メトキシ-3-(3-トリフルオロメチルベンジル)チオ-1, 2, 4-チアジアゾール(以下、本発明化合物21と記す。)



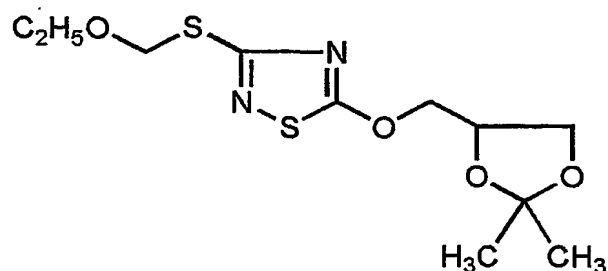
$^1\text{H-NMR}$: 7.69 (s, 1H) 7.61 (d, 1H) 7.50 (d, 1H) 7.42 (t, 1H) 4.55-4.42 (m, 5H) 4.15-4.11 (m, 1H) 3.84-3.81 (m, 1H) 1.45 (s, 3H) 1.38 (s, 3H)

【0083】

製造例 22

N, N-ジメチルホルムアミド 3 g に 5-クロロ-3-エトキシメチルチオ-1, 2, 4-チアジアゾール 300 mg と 2, 2-ジメチル-1, 3-ジオキサラン-4-メタノール 188 mg とを溶解し、約 0℃ で水素化ナトリウム (60% 油性) 62 mg を加え、約 0℃ で 30 分間攪拌した後、室温で約 1 日間静置した。その後、反応混合物に t-ブチルメチルエーテル及び飽和食塩水を加え、分液した。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥し、濃縮して得られた残渣をカラムクロマトグラフィーに付し、5-(2, 2-ジメチル-1, 3-ジオキサラン-4-イル) メトキシ-3-エトキシメチルチオ-1, 2, 4-チアジアゾール 30 mg を得た。

5-(2, 2-ジメチル-1, 3-ジオキサラン-4-イル) メトキシ-3-エトキシメチルチオ-1, 2, 4-チアジアゾール (以下、本発明化合物 22 と記す。)



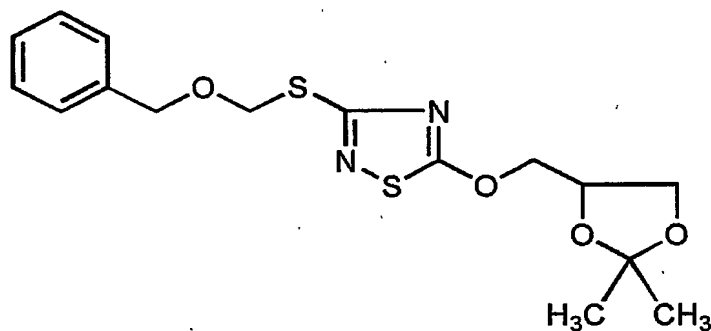
$^1\text{H-NMR}$: 5.39 (s, 2H) 4.58-4.47 (m, 3H) 4.16-4.11 (m, 1H) 3.86-3.82 (m, 1H) 3.68-3.63 (q, 2H) 1.45 (s, 3H) 1.39 (s, 3H) 1.23 (t, 3H)

【0084】

製造例 23

N, N-ジメチルホルムアミド 3 g に 5-クロロ-3-ベンジルオキシメチルチオ-1, 2, 4-チアジアゾール 350 mg と 2, 2-ジメチル-1, 3-ジオキサラン-4-メタノール 169 mg とを溶解し、約 0℃ で水素化ナトリウム (60% 油性) 56 mg を加え、同温で 2 時間攪拌した。その後、反応混合物に t-ブチルメチルエーテル及び飽和食塩水を加え、分液した。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥し、濃縮して得られた残渣をカラムクロマトグラフィーに付し 5-(2, 2-ジメチル-1, 3-ジオキサラン-4-イル) メトキシ-3-ベンジルオキシメチルチオ-1, 2, 4-チアジアゾール 330 mg を得た。

5-(2, 2-ジメチル-1, 3-ジオキサラン-4-イル) メトキシ-3-ベンジルオキシメチルチオ-1, 2, 4-チアジアゾール (以下、本発明化合物 23 と記す。)



$^1\text{H-NMR}$: 7.36-7.28 (m, 5H) 5.41 (s, 2H) 4.69 (s, 2H) 4.57-4.46 (m, 3H) 4.16-4.11 (m, 1H) 3.85-3.82 (m, 1H) 1.45 (s, 3H) 1.39 (s, 3H)

【0085】

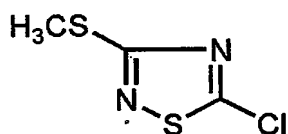
次に、本発明化合物の製造中間体である 5-クロロ-1, 2, 4-チアジアゾール化合物の製造につき、参考製造例として示す。

【0086】

参考製造例 1

水 100 ml にメチルイソチオ尿素硫酸塩 18.7 g、パークロロメチルメルカプタン 25 g、ドデシル硫酸ナトリウム 0.15 g を加え、約 0℃ で水酸化ナトリウム 21 g を水 100 ml に溶解した溶液を約 4 時間かけて滴下した。滴下終了後、同温で 2 時間攪拌した。その後、反応混合物にトリーブチルメチルエーテルを加え抽出した。有機層を濃縮し、得られた残渣を減圧蒸留、次いでシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル = 25 : 1）に付し 3-メチルチオ-5-クロロ-1, 2, 4-チアジアゾール 7.64 g を得た。

3-メチルチオ-5-クロロ-1, 2, 4-チアジアゾール



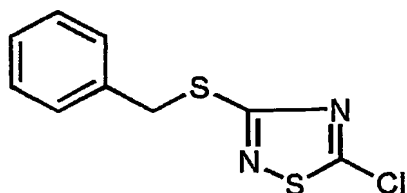
$^1\text{H-NMR}$: 2.66 (s, 3H)

【0087】

参考製造例 2

トルエン 20 ml 及び水 10 ml の混合物にベンジルイソチオ尿素塩酸塩 2.02 g、パークロロメチルメルカプタン 1.86 g 及びベンジルトリエチルアンモニウムクロライド 46 mg を加え、約 0℃ で水酸化ナトリウム 1.6 g を水 10 ml に溶解した溶液を滴下し、2 時間攪拌した。その後、反応混合物にトリーブチルメチルエーテルを加え、抽出した。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥し、濃縮して得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル = 20 : 1）に付し、3-ベンジルチオ-5-クロロ-1, 2, 4-チアジアゾール 900 mg を得た。

3-ベンジルチオ-5-クロロ-1, 2, 4-チアジアゾール



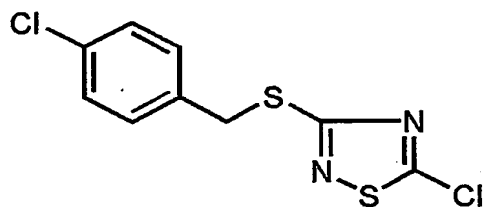
$^1\text{H-NMR}$: 7.60-7.20 (m, 5H) 4.45 (s, 2H)

【0088】

参考製造例 3

トルエン 80 ml 及び水 40 ml の混合物に 4-クロロベンジルイソチオ尿素塩酸塩 10.0 g、パークロロメチルメルカプタン 7.85 g 及びベンジルトリエチルアンモニウムクロライド 192 mg を加え、約 0℃ で水酸化ナトリウム 6.75 g を水 40 ml に溶解した溶液を 3 時間かけて滴下した。その後、反応混合物に *t*-ブチルメチルエーテルを加え、抽出した。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥し、濃縮して得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィーに付し、3-(4-クロロベンジル)チオ-5-クロロ-1, 2, 4-チアジアゾール 5.38 g を得た。

3-(4-クロロベンジル)チオ-5-クロロ-1, 2, 4-チアジアゾール



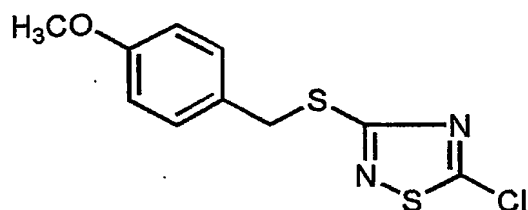
$^1\text{H-NMR}$: 7.37 (d, 2H) 7.27 (d, 2H) 4.40 (s, 2H)

【0089】

参考製造例 4

トルエン 20 ml 及び水 10 ml の混合物に 4-メトキシベンジルイソチオ尿素塩酸塩 2.53 g、パークロロメチルメルカプタン 2.03 g 及びベンジルトリエチルアンモニウムクロライド 50 mg を加え、約 0℃ で水酸化ナトリウム 1.74 g を水 10 ml に溶解した溶液を 4 時間かけて滴下した。滴下終了後、さらに室温で 1 時間攪拌した。その後、反応混合物に *t*-ブチルメチルエーテルを加え、抽出した。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥し、濃縮して得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィーに付し、3-(4-メトキシベンジル)チオ-5-クロロ-1, 2, 4-チアジアゾール 5.38 g を得た。

3-(4-メトキシベンジル)チオ-5-クロロ-1, 2, 4-チアジアゾール



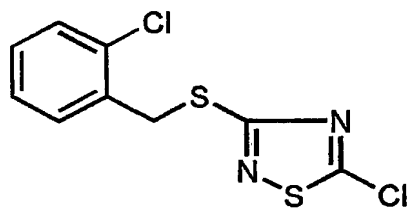
$^1\text{H-NMR}$: 7.35 (d, 2H) 6.85 (d, 2H) 4.41 (s, 2H)
3.79 (s, 3H)

【0090】

参考製造例 5

トルエン 80 ml 及び水 40 ml の混合物に 2-クロロベンジルイソチオ尿素塩酸塩 10.0 g、パークロロメチルメルカプタン 7.85 g 及びベンジルトリエチルアンモニウムクロライド 192 mg を加え、約 0℃ で水酸化ナトリウム 5.27 g を水 40 ml に溶解した溶液を 1 時間かけて滴下した。その後、反応混合物に *n*-ブチルメチルエーテルを加え、抽出した。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥し、濃縮して得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィーに付し 3-(2-クロロベンジル)チオ-5-クロロ-1,2,4-チアジアゾール 0.78 g を得た。

3-(2-クロロベンジル)チオ-5-クロロ-1,2,4-チアジアゾール



$^1\text{H-NMR}$: 7.55 (d, 1H) 7.49 (d, 1H) 7.22 (m, 2H)
4.57 (s, 2H)

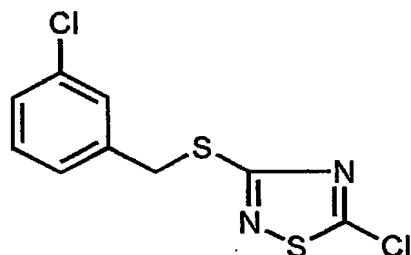
【0091】

参考製造例 6

トルエン 80 ml 及び水 40 ml の混合物に 3-クロロベンジルイソチオ尿素塩酸塩 10.0 g、パークロロメチルメルカプタン 7.85 g 及びベンジルトリエチルアンモニウムクロライド 192 mg を加え、約 0℃ で水酸化ナトリウム 5.27 g を水 40 ml に溶解した溶液を 1 時間かけて滴下した。その後、反応混

合物に *t*-ブチルメチルエーテルを加え、抽出した。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥し、濃縮して得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィーに付し 3-(3-クロロベンジル)チオ-5-クロロ-1,2,4-チアジアゾール 1.30 g を得た。

3-(3-クロロベンジル)チオ-5-クロロ-1,2,4-チアジアゾール



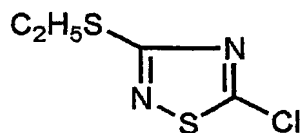
$^1\text{H-NMR}$: 7.43 (s, 1H) 7.31-7.22 (m, 3H) 4.41 (s, 2H)

【0092】

参考製造例 7

水 60 ml にエチルイソチオ尿素臭化水素塩 10.3 g、パークロロメチルメルカプタン 10.4 g を加え、約 0℃ で水酸化ナトリウム 9.39 g を水 60 ml に溶解した溶液をゆっくり滴下した。その後、反応混合物に *t*-ブチルメチルエーテルを加え、抽出した。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥し、濃縮して得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル = 30 : 1）に付し、3-エチルチオ-5-クロロ-1,2,4-チアジアゾール 2.54 g を得た。

3-エチルチオ-5-クロロ-1,2,4-チアジアゾール



$^1\text{H-NMR}$: 3.22 (q, 2H) 1.44 (t, 3H)

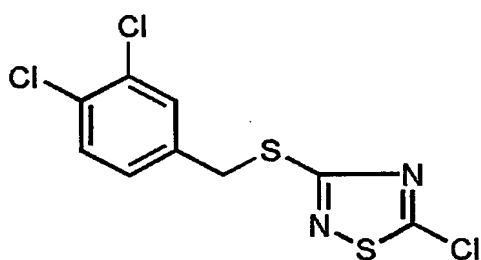
【0093】

参考製造例 8

水 50 ml に 3,4-ジクロロベンジルイソチオ尿素塩酸塩 12.9 g 及びパ

ークロロメチルメルカプタン 8. 82 g を加え、約 0℃ で水酸化ナトリウム 7. 58 g を水 50 m l に溶解した溶液を徐々に滴下し、4 時間攪拌した。その後、反応混合物に *tert*-ブチルメチルエーテルを加え、抽出した。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥し、濃縮して得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィーにより、3-(3, 4-ジクロロベンジル) チオ-5-クロロ-1, 2, 4-チアジアゾール 3. 1 g を粗生成物として得た。

3-(3, 4-ジクロロベンジル) チオ-5-クロロ-1, 2, 4-チアジアゾール

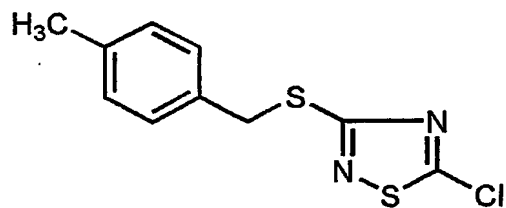


【0094】

参考製造例 9

水 50 m l に 4-メチルベンジルイソチオ尿素塩酸塩 9. 46 g 及びパークロロメチルメルカプタン 8. 11 g を加え、約 0℃ で水酸化ナトリウム 6. 98 g を水 50 m l に溶解した溶液を滴下し 4 時間攪拌した。その後、反応混合物に *tert*-ブチルメチルエーテルを加え、抽出した。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥し、濃縮して得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィーに付し、3-(4-メチルベンジル) チオ-5-クロロ-1, 2, 4-チアジアゾール 3. 6 g を粗生成物として得た。

3-(4-メチルベンジル) チオ-5-クロロ-1, 2, 4-チアジアゾール

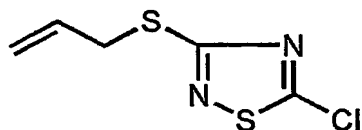


【0095】

参考製造例 10

水 50 ml にアリルイソチオ尿素塩酸塩 9.33 g 及びパークロロメチルメルカプタン 8.82 g を加え、約 0℃ で水酸化ナトリウム 7.58 g を水 50 ml を溶解した溶液を滴下し、4 時間攪拌した。その後、反応混合物に *tert*-ブチルメチルエーテルを加え、抽出した。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥し、濃縮して得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィーに付し、3-アリルチオ-5-クロロ-1, 2, 4-チアジアゾール 3.6 g を得た。

3-アリルチオ-5-クロロ-1, 2, 4-チアジアゾール

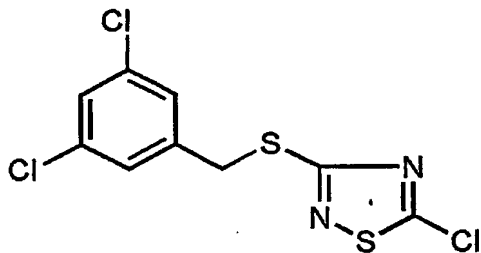


$^1\text{H-NMR}$: 6.03–5.83 (m, 1H) 5.34 (d, 1H) 5.19 (d, 1H) 3.88 (d, 1H)

【0096】

参考製造例 11

水 25 ml 及びジクロロメタン 25 ml の混合物に 3, 5-ジクロロベンジルイソチオ尿素塩酸塩 8.95 g 及びパークロロメチルメルカプタン 6.12 g を加え、約 0℃ で水酸化ナトリウム 5.26 g を水 50 ml 溶解した溶液を約 3 時間かけて滴下した。滴下終了後、さらに室温で 1 時間攪拌した。その後、反応混合物にクロロホルムを加え抽出した。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥し、濃縮して得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル＝30：1）により、3-(3, 5-ジクロロベンジル)チオ-5-クロロ-1, 2, 4-チアジアゾールの祖生成物 2.4 g を得た。

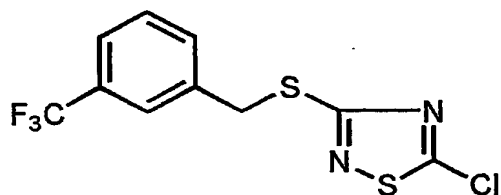


【0097】

参考製造例 12

水 25 ml 及びジクロロメタン 50 ml の混合物に 3-トリフルオロメチルベンジルイソチオ尿素塩酸塩 12.0 g 及びパークロロメチルメルカプタン 8.24 g を加え、約 0℃ で水酸化ナトリウム 7.09 g を水 25 ml を溶解した溶液を約 1.5 時間かけて滴下した。滴下終了後、さらに室温で 2 時間攪拌した。その後、反応混合物にクロロホルムを加え抽出した。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥し、濃縮して得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル＝20：1）に付し、3-（3-トリフルオロメチルベンジル）チオ-5-クロロ-1, 2, 4-チアジアゾール 5.9 g を得た。

3-（3-トリフルオロメチルベンジル）-5-クロロ-1, 2, 4-チアジアゾール



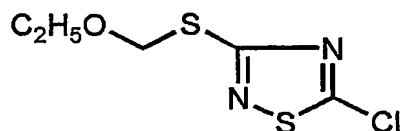
$^1\text{H-NMR}$: 7.69 (s, 1H) 7.61 (d, 1H) 7.52 (d, 1H) 7.44 (t, 1H) 4.47 (s, 2H)

【0098】

参考製造例 13

水 35 ml 及びジクロロメタン 70 ml の混合物にエトキシメチルイソチオ尿素塩酸塩 12.2 g 及びパークロロメチルメルカプタン 13.2 g を加え、約 0℃ で水酸化ナトリウム 11.4 g を水 35 ml に溶解した溶液を約 1.5 時間かけて滴下した。滴下終了後、さらに室温で 1 時間攪拌した。その後、反応混合物にクロロホルムを加え抽出した。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥し、濃縮して得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィーに付し 3-エトキシメチルチオ-5-クロロ-1, 2, 4-チアジアゾール 5.22 g を得た。

3-エトキシメチルチオ-5-クロロ-1, 2, 4-チアジアゾール



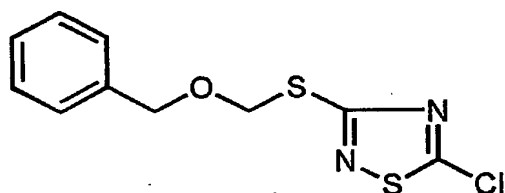
$^1\text{H-NMR}$: 5.43 (s, 2H) 3.68 (q, 2H) 1.26 (t, 3H)

【0099】

参考製造例 14

水 25 ml 及びジクロロメタン 50 ml にベンジルオキシメチルイソチオ尿素塩酸塩 11.3 及びパークロロメチルメルカプタン 9.02 g を加え、約 0℃ で水酸化ナトリウム 7.76 g を水 25 ml に溶解した溶液を約 1.5 時間かけて滴下した。滴下終了後、さらに室温で 1 時間攪拌した。その後、反応混合物にクロロホルムを加え抽出した。有機層を無水硫酸ナトリウムで乾燥し、濃縮して得られた残渣をシリカゲルクロマトグラフィーに付し 3-ベンジルオキシメチルチオ-5-クロロ-1, 2, 4-チアジアゾール 3.51 g を得た。

3-ベンジルオキシメチルチオ-5-クロロ-1, 2, 4-チアジアゾール



$^1\text{H-NMR}$: 7.36-7.28 (m, 5H) 5.45 (s, 2H) 4.69 (s, 2H)

【0100】

次に、製剤例を示す。なお、部は重量部を表す。

製剤例 1

本発明化合物 1~23 の各々 9 部を、キシレン 37.5 部および N, N-ジメチルホルムアミド 37.5 部に溶解し、これにポリオキシエチレンスチリルフェニルエーテル 10 部およびドデシルベンゼンスルホン酸カルシウム 6 部を加え、よく攪拌混合して各々の乳剤を得る。

【0101】

製剤例 2

本発明化合物 1~23 の各々 9 部を、ラウリル硫酸ナトリウム 4 部、リグニンスルホン酸カルシウム 2 部、合成含水酸化珪素微粉末 20 部および珪素土 65 部

を混合した中に加え、よく攪拌混合して各々の水和剤を得る。

【 0 1 0 2 】

製剤例 3

本発明化合物 1 ～ 2 3 の各々 3 部、合成含水酸化珪素微粉末 5 部、ドデシルベンゼンスルホン酸ナトリウム 5 部、ベントナイト 3 0 部およびクレー 5 7 部を加え、よく攪拌混合し、ついでこれらの混合物に適当量の水を加え、さらに攪拌し、増粒機で製粒し、通風乾燥して各々の粒剤を得る。

【 0 1 0 3 】

製剤例 4

本発明化合物 1 ～ 2 3 の各々 4 . 5 部、合成含水酸化珪素微粉末 1 部、凝集剤としてドリレス B (三共社製) 1 部、クレー 7 部を乳鉢でよく混合した後にジュースミキサーで攪拌混合する。得られた混合物にカットクレー 8 6 . 5 部を加えて、充分攪拌混合し各々の粉剤を得る。

【 0 1 0 4 】

製剤例 5

本発明化合物 1 ～ 2 3 の各々 1 0 部、ポリオキシエチレンアルキルエーテルサルフェートアンモニウム塩 5 0 部を含むホワイトカーボン 3 5 部及び水 5 5 部を混合し、湿式粉碎法で微粉碎することにより各々の製剤を得る。

【 0 1 0 5 】

製剤例 6

本発明化合物 1 ～ 2 3 の各々 0 . 5 部をジクロロメタン 1 0 部に溶解し、これをアイソパー M (イソパラフィン : エクソン化学登録商標名) 8 9 . 5 部に混合して油剤を得る。

【 0 1 0 6 】

製剤例 7

本発明化合物 1 ～ 2 3 の各々の 0 . 1 部、ネオチオゾール (中央化成株式会社) 4 9 . 9 部をエアゾール缶に入れ、エアゾールバルブを装着した後、2 5 部のジメチルエーテル及び 2 5 部の L P G を充填し、振とうを加え、アクチュエータを装着することにより油性エアゾールを得る。

【 0 1 0 7 】

製剤例 8

本発明化合物 1 ～ 2 3 の各々の 0 . 6 部、B H T 0 . 0 1 部、キシレン 5 部、脱臭灯油 3 . 3 9 部および乳化剤 { アトモス 3 0 0 (アトモスケミカル社登録商標名) } 1 部を混合溶解したものと、蒸留水 5 0 部とをエアゾール容器に充填し、バルブ部分を取り付け、該バルブを通じて噴射剤 (L P G) 4 0 部を加圧充填して、水性エアゾールを得る。

【 0 1 0 8 】

続いて、本発明化合物が有害節足動物防除剤の有効成分として有用であることを試験例により示す。

【 0 1 0 9 】

試験例

前記製剤例 5 により得られた供試化合物の製剤を有効成分濃度が 5 0 0 p p m となるように水で希釈して、試験用薬液を調製した。

一方、ポリエチレンカップにキュウリを植え、第 1 本葉が展開するまで生育させ、そこにワタアブラムシ約 2 0 頭を寄生させた。1 日後、そのキュウリに上記の試験用薬液を 2 0 m l / カップの割合で散布した。散布 6 日後に生存しているワタアブラムシの数を調査した。

その結果、本発明化合物 1 ～ 9、1 1、1 3 ～ 1 5、1 7 ～ 2 3 の処理区は各々生存していたワタアブラムシは 3 頭以下であったが、無処理区では 2 0 頭以上であった。

【 0 1 1 0 】

【 発明の効果 】

本発明化合物は優れた有害節足動物防除活性を有することから、本発明化合物は有害節足動物防除剤の有効成分として有用である。

【書類名】 要約書

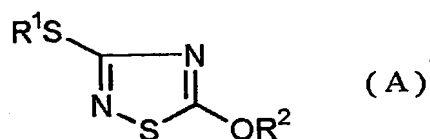
【要約】

【課題】

有害節足動物防除効力を有する新しい化合物及びその化合物の有害節足動物防除用途を提供すること。

【解決手段】

式 (A)



【式中、

R¹は

C1-C7アルキル基等を表し、

R²は（置換されていてもよい含酸素又は含硫黄5員環複素環式基）で置換されたC1-C4アルキル基を表す。］で示されるチアジアゾール化合物、該チアジアゾール化合物を有効成分として含有することを特徴とする有害節足動物防除剤及び該チアジアゾール化合物の有効量を有害節足動物又は有害節足動物の生息場所に施用することを特徴とする有害節足動物の防除方法。

【選択図】 なし

出 願 人 履 歴 情 報

識別番号

[000002093]

1. 変更年月日 1990年 8月28日

[変更理由] 新規登録

住 所 大阪府大阪市中央区北浜4丁目5番33号

氏 名 住友化学工業株式会社